

M/40251-US



16

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)(51) Internationale Patentklassifikation ⁶:

C07D 239/32, A01N 43/54

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/33874

(43) Internationales
Veröffentlichungsdatum:

18. September 1997 (18.09.97)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP97/01123

(22) Internationales Anmeldedatum: 6. März 1997 (06.03.97)

(30) Prioritätsdaten:

196 09 618.9

12. März 1996 (12.03.96)

DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): OBERDORF, Klaus [DE/DE]; Bienenstrasse 3, D-69117 Heidelberg (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]; Borsigstrasse 5, D-67063 Ludwigshafen (DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20, D-68167 Mannheim (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Breslauer Strasse 6, D-67105 Schifferstadt (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, D-67227 Frankenthal (DE). KIRSTGEN, Reinhard [DE/DE]; Erkenbrechtstrasse 23c, D-67434 Neustadt (DE). BAYER, Herbert [DE/DE]; D 3.4, D-68159 Mannheim (DE). PTOCK, Arne [DE/DE]; Eichenstrasse 23, D-67067 Ludwigshafen (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, D-69123 Heidelberg (DE). HARREUS, Albrecht [DE/DE]; Beuthener Strasse 10, D-67063 Ludwigshafen

(DE). RÖHL, Franz [DE/DE]; Sebastian-Kneipp-Strasse 2, D-67105 Schifferstadt (DE). AMMERMAN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, D-64646 Heppenheim (DE). HARRIES, Volker [DE/DE]; Immengärtenweg 29e, D-67227 Frankenthal (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, D-67434 Hambach (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, D-67117 Limburgerhof (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, CA, CN, CZ, GE, HU, IL, JP, KR, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

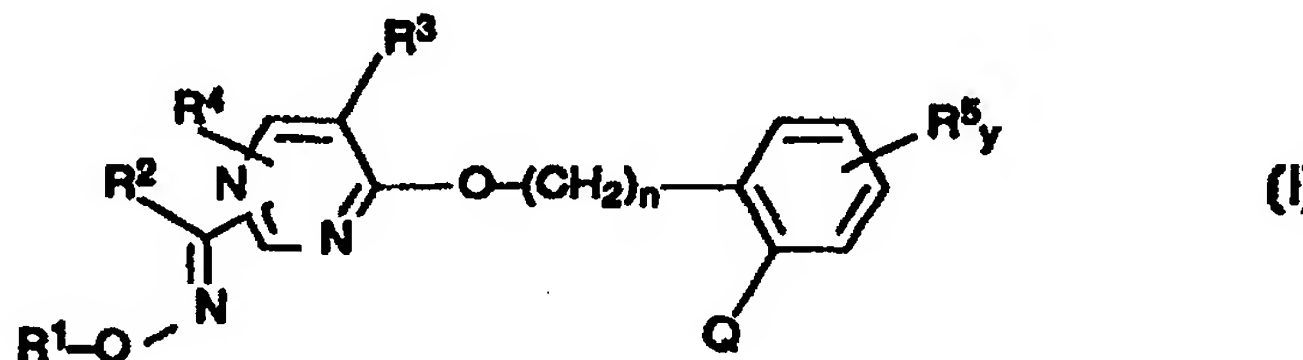
Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.

(54) Title: PYRIMIDYL PHENYL AND BENZYL ETHERS, PROCESS AND INTERMEDIATE PRODUCTS FOR THEIR PRODUCTION AND THEIR USE AS HERBICIDE

(54) Bezeichnung: PYRIMIDYLPHENYL- UND -BENZYLETHER, VERFAHREN UND ZWISCHENPRODUKTE ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS FUNGIZIDE

(57) Abstract

Pyrimidyl phenyl and benzyl ethers of general formula (I) and their salts and N oxides, in which the constituents and indices have the meanings: Q is C(CO₂CH₃)-CHCH₃, C(CO₂CH₃)-CHOCH₃, C(CONHCH₃)-CHOCH₃, C(CONH₂)-NOCH₃, C(CONHCH₃)-NOCH₃ or N(OCH₃)-CO₂CH₃; n is 0 or 1; R¹ is hydrogen or an organic radical bonded via a carbon atom; R² is hydrogen, cyano, halogen or an organic radical bonded via a carbon, oxygen, sulphur or nitrogen atom; R³ is hydrogen, halogen, C₁-C₄ alkyl or C₁-C₂ alkyl halide; R⁴ is hydrogen, cyano, nitro, halogen or an organic radical bonded via a carbon, oxygen, sulphur or nitrogen atom; y is 0, 1, 2 or 3, where the radicals R⁵ may be different if y is 2 or 3; R⁵ is cyano, halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide or C₁-C₄ alkoxy; process and intermediate products for their production and their use as herbicide.



(57) Zusammenfassung

Pyrimidylphenyl- und -benzylether der allgemeinen Formel (I), sowie deren Salze und N-Oxide, in denen die Substituenten und Indices die folgende Bedeutung haben: Q C(CO₂CH₃)-CHCH₃, C(CO₂CH₃)-CHOCH₃, C(CONHCH₃)-CHOCH₃, C(CONH₂)-NOCH₃, C(CONHCH₃)-NOCH₃ oder N(OCH₃)-CO₂CH₃; n 0 oder 1; R¹ Wasserstoff oder ein über ein Kohlenstoff-Atom gebundener organischer Rest; R² Wasserstoff, Cyano, Halogen oder ein über ein Kohlenstoff-, Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom gebundener organischer Rest; R³ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl; R⁴ Wasserstoff, Cyano, Nitro, Halogen oder ein über ein Kohlenstoff-, Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom gebundener organischer Rest; y 0, 1, 2 oder 3, wobei die Reste R⁵ verschieden sein können, wenn y für 2 oder 3 steht; R⁵ Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

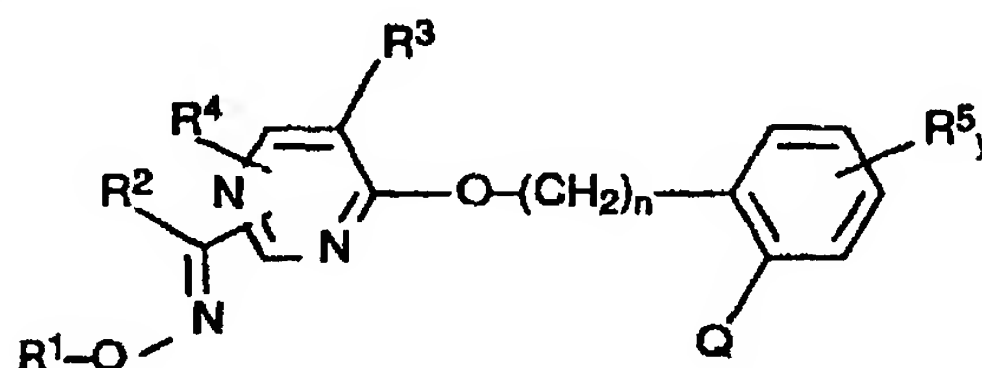
AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumänien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		

PYRIMIDYLPHENYL- UND -BENZYLETHER, VERFAHREN UND ZWISCHENPRODUKTE ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS FUNGIZIDE

5 Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Pyrimidylphenyl- und -benzylether der allgemeinen Formel I

10



15 sowie deren Salze und N-Oxide, in denen die Substituenten und Indices die folgende Bedeutung haben:

Q C(CO₂CH₃)=CHCH₃, C(CO₂CH₃)=CHOCH₃, C(CONHCH₃)=CHOCH₃,
C(CONH₂)=NOCH₃, C(CONHCH₃)=NOCH₃ oder N(OCH₃)-CO₂CH₃;

20

n 0 oder 1;

R¹ Wasserstoff oder

25 ein über ein Kohlenstoff-Atom gebundener organischer Rest;

R² Wasserstoff, Cyano, Halogen oder

30

ein über ein Kohlenstoff-, Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom gebundener organischer Rest;

R³ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl;

R⁴ Wasserstoff, Cyano, Nitro, Halogen oder

35

ein über ein Kohlenstoff-, Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom gebundener organischer Rest;

40 y 0, 1, 2 oder 3, wobei die Reste R⁵ verschieden sein können, wenn y für 2 oder 3 steht;

R⁵ Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy.

45

Desweiteren betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen.

5 Aus der Literatur (EP-A 254 426; EP-A 278 595; EP-A 299 694; EP-A 363 818; EP-A 350 691; EP-A 398 692; EP-A 407 873; EP-A 477 631; EP-A 513 580; JP-A 04/182,461; WO-A 93/15,046) sind Pyrimidyl-phenyl- und -benzylether mit fungiziden bzw. fungiziden und insektiziden Eigenschaften bekannt, die sich von den erfindungs-
10 gemäßen Verbindungen durch die Substituenten im Pyrimidylteil unterscheiden.

Demgegenüber lagen der vorliegenden Erfindung Verbindungen mit verbesserter Wirkung und verbreitertem Wirkungsspektrum als Auf-
15 gabe zugrunde.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen I gefunden. Desweiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung
20 fung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen gefunden.

Die Verbindungen I sind auf verschiedenen Wegen nach an sich in der Literatur beschriebenen Verfahren erhältlich.

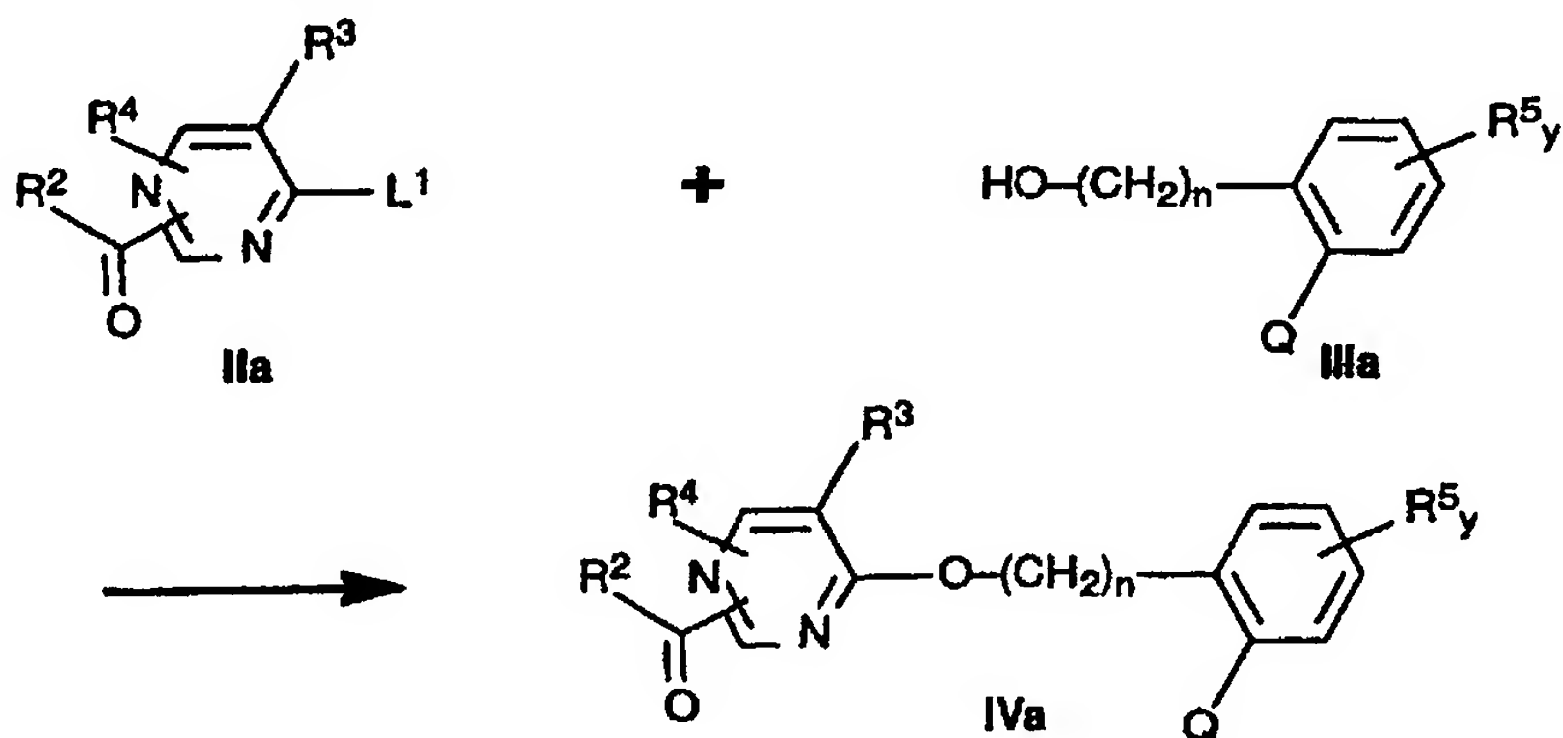
25 Der Aufbau der Gruppierung Q ist beispielsweise aus der eingangs zitierten Literatur bekannt und erfolgt im allgemeinen und im besonderen nach den dort beschriebenen Verfahren.

Üblicherweise geht man bei der Synthese der Verbindungen I so
30 vor, daß man ein Pyrimidinderivat der Formel IIa in einem inerten Lösungsmittel mit einem Phenol bzw. Benzylalkohol der Formel IIIa in den entsprechenden Ether der Formel IVa überführt und IVa anschließend mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz zu I umsetzt.

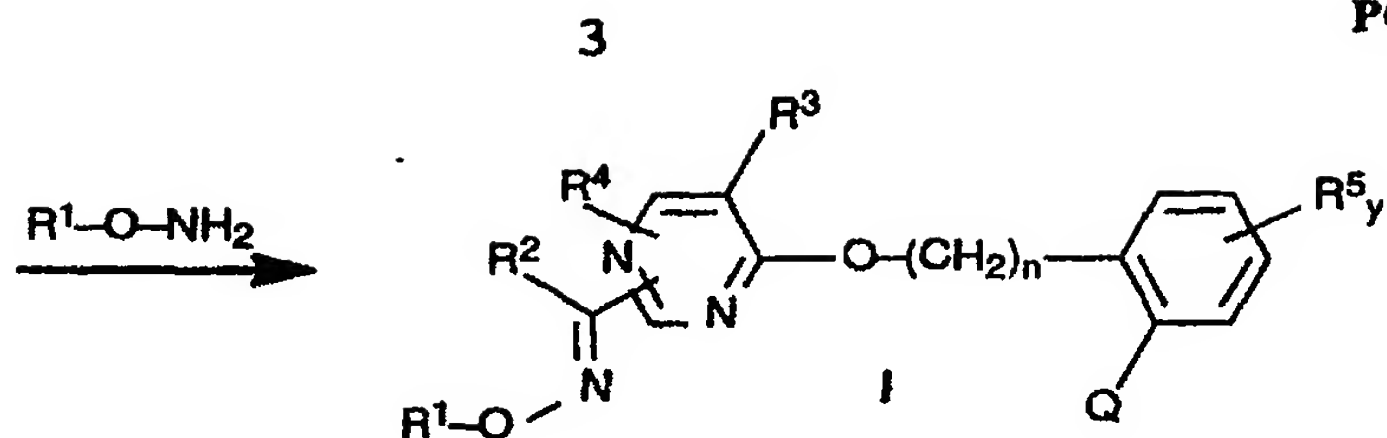
35

40

45



5



10 L^1 in der Formel IIa steht für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe wie Halogen (z.B. Fluor, Chlor, Brom oder Iod) oder Alkyl- oder Arylsulfonat (z.B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfonat, Phenylsulfonat oder Methylphenylsulfonat).

15 1a) Die Umsetzung von IIa mit IIIa erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von 0°C bis 130°C, vorzugsweise 20°C bis 80°C in Gegenwart einer Base.

20 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylether, sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Tetrahydrofuran, Acetonitril, Dimethylsulfoxid und Aceton. Es können auch Ge-

25 mische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

30 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid

35 sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kaliumtert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyrimidine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders

40

45

5

bevorzugt werden Kaliumcarbonat, Natriumhydrid und Kaliumtert.-butylat. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

10

- 1b) Die Umsetzung von IVa mit dem O-substituierten Hydroxylamin oder dessen Salz erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von 0°C bis 80°C, vorzugsweise 20°C bis 60°C, ggf. in Gegenwart einer Säure oder ggf. in Gegenwart einer Base, wenn das O-substituierte Hydroxylamin aus seinem Salz freigesetzt wird.

20

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Pyridin, besonders bevorzugt Methanol und Pyridin. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

25

30

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kaliumtert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, sub-

35

40

45

5

stituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Pyridin und Natriumhydroxid. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

10

Als Säuren und saure Katalysatoren finden anorganische Säuren wie Fluorwasserstoffsäure, Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure und Perchlorsäure, Lewis-Säuren wie Bortrifluorid, Aluminiumtrichlorid, Eisen-III-chlorid, Zinn-IV-chlorid, Titan-IV-chlorid und Zink-II-chlorid, sowie organische Säuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Zitronensäure und Trifluoressigsäure Verwendung. Die Säuren werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt.

15

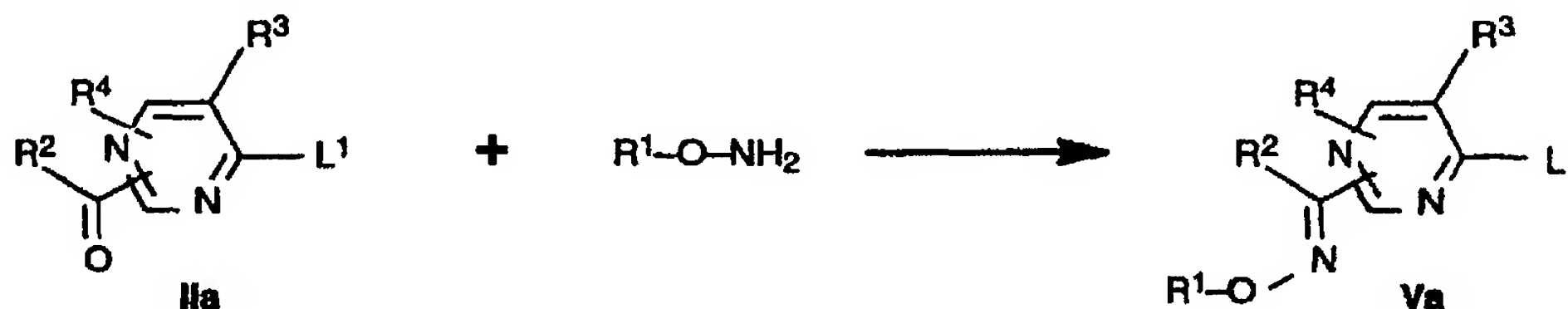
20

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, das Hydroxylamin bzw. dessen Salz in einem Überschuß bezogen auf IVa einzusetzen.

25

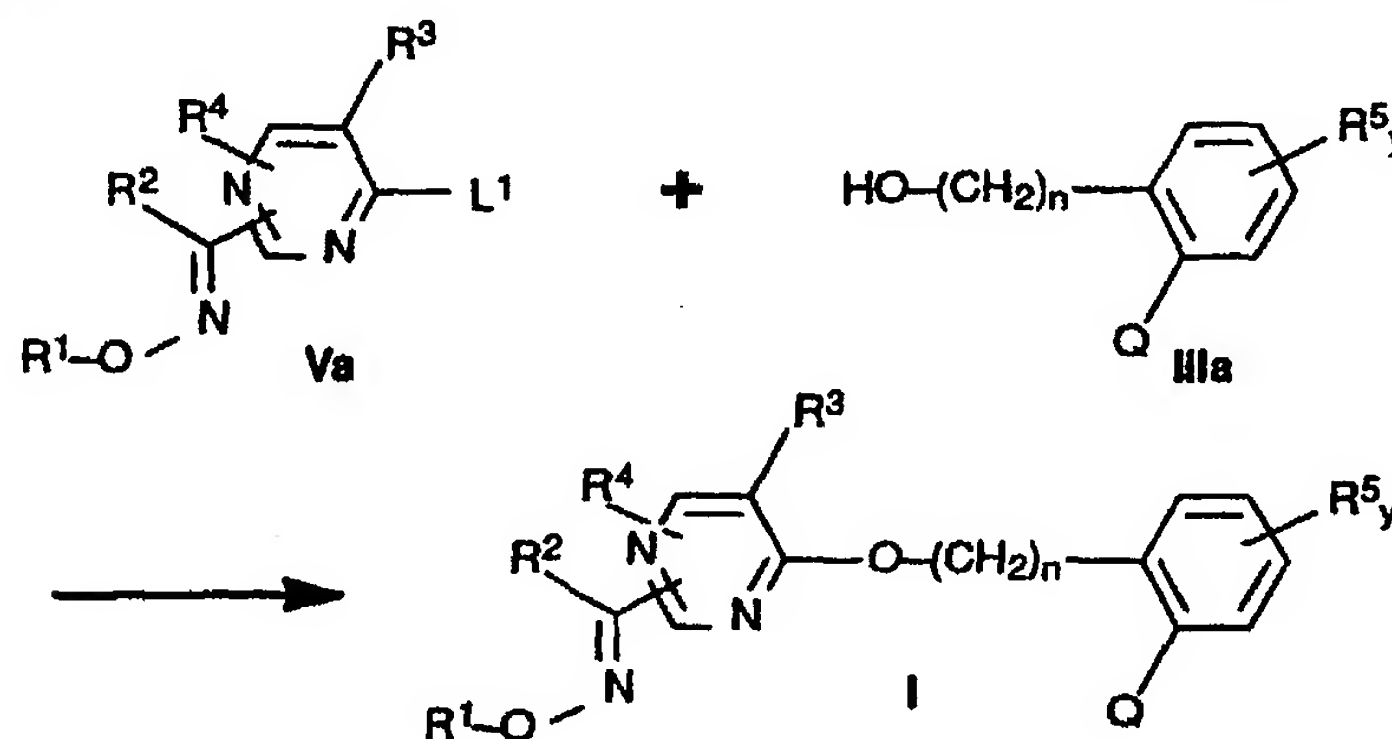
In entsprechender Weise erhält man die Verbindungen I dadurch, daß man ein Pyrimidinderivat der Formel IIa zunächst mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz in die entsprechende Verbindung der Formel Va überführt und Va anschließend in einem inerten Lösungsmittel mit einem Phenol bzw. Benzylalkohol der Formel IIIa zu I umsetzt.

30



35

40



45

Die Umsetzungen erfolgen im allgemeinen und im besonderen nach den vorstehend beschriebenen Methoden.

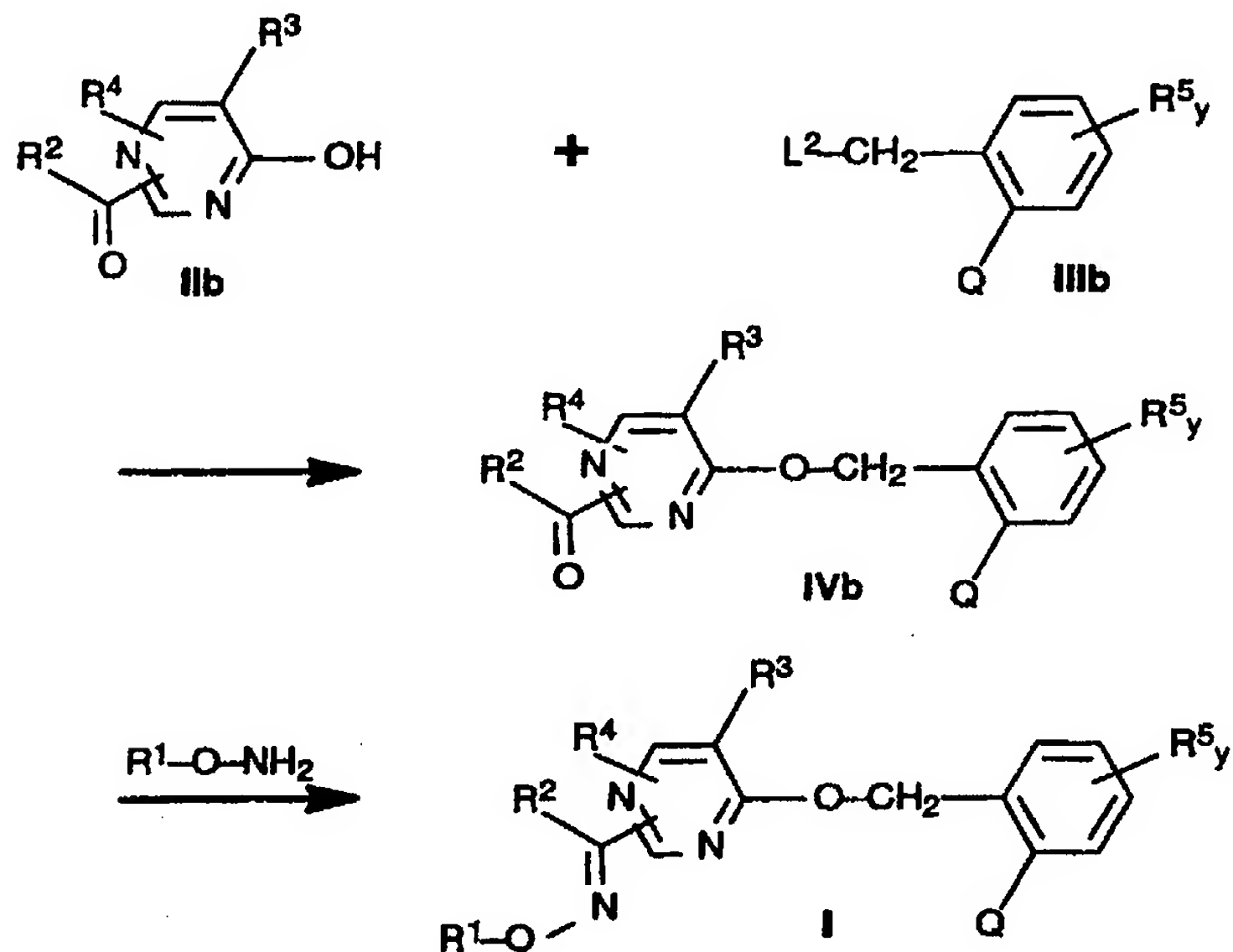
Verbindungen I, in denen n für 1 steht, erhält man bevorzugt dadurch, daß man einen Pyrimidinalkohol der Formel IIb in einem inerten Lösungsmittel mit einer Benzylverbindung der Formel IIIb in den entsprechenden Benzylether der Formel IVb überführt und IVb anschließend mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz zu I umsetzt.

10

15

20

25



L^2 in der Formel IIIb steht für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe wie Halogen (z.B. Chlor, Brom oder Iod) oder Alkyl- oder Arylsulfonat (z.B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfonat, Phenylsulfonat oder Methylphenylsulfonat).

2a) Die Umsetzung von IIb mit IIIb erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von $0^\circ C$ bis $130^\circ C$, vorzugsweise $20^\circ C$ bis $60^\circ C$ in Gegenwart einer Base.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Tetrahydrofuran, Acetonitril, Dimethylsulfoxid und

Aceton. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- 5 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kaliumtert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische
- 10 Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Kaliumcarbonat, Natriumhydrid und Kaliumtert.-butylat. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.
- 15
- 20
- 25
- 30 Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, IIb in einem Überschuß bezogen auf IIIb einzusetzen.
- 35 2b) Die Umsetzung von IVb mit dem O-substituierten Hydroxylamin oder dessen Salz erfolgt im allgemeinen und im besonderen nach den vorstehend unter Punkt 1b beschriebenen Bedingungen.
- 40 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran,
- 45 Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und

Pyridin, besonders bevorzugt Methanol und Pyridin. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

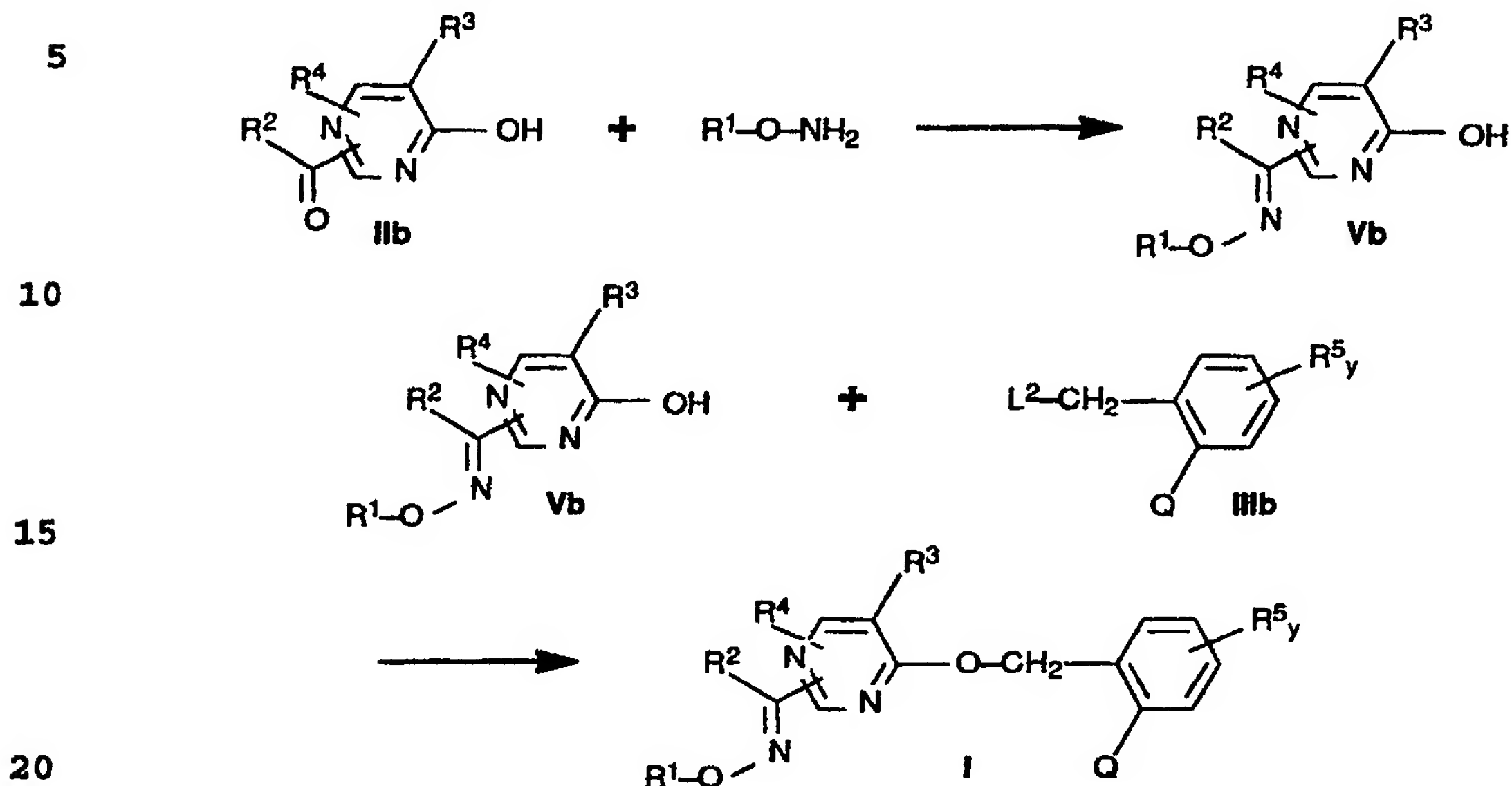
5 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kaliumtert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische
10 Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Pyridin und Natriumhydroxid. Die Basen werden
15 im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Als Säuren und saure Katalysatoren finden anorganische Säuren wie Fluorwasserstoffsäure, Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure und Perchlorsäure, Lewis-Säuren wie Bortrifluorid, Aluminiumtrichlorid, Eisen-III-chlorid, Zinn-IV-chlorid, Titan-IV-chlorid und Zink-II-chlorid, sowie organische Säuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Zitronensäure und Trifluoressigsäure Verwendung.
20 Die Säuren werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft
35 sein, IIb in einem Überschuß bezogen auf IIIb einzusetzen.

In entsprechender Weise erhält man die Verbindungen I, in denen
40 n für 1 steht, dadurch, daß man einen Pyrimidinalkohol der Formel I mit IIb zunächst mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-

NH₂) oder dessen Salz in die entsprechende Verbindung der Formel Vb überführt und Vb anschließend in einem inerten Lösungsmittel mit einer Benzylverbindung der Formel IIIb zu I umsetzt.



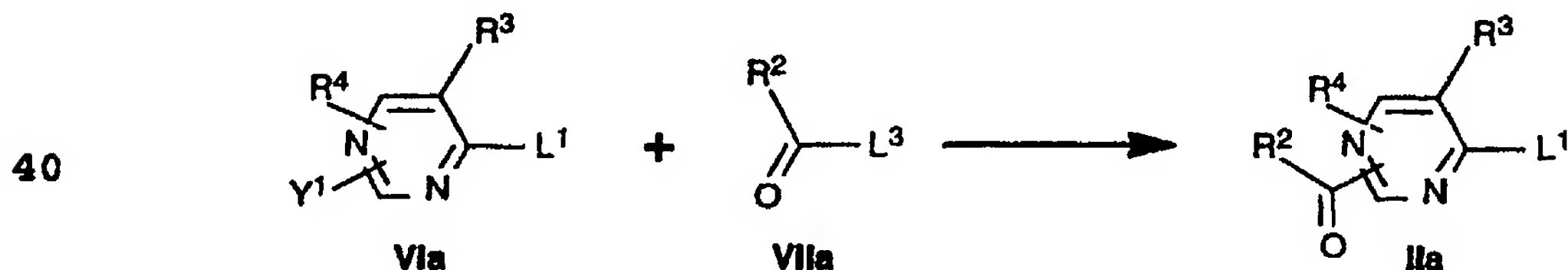
Die Umsetzungen erfolgen im allgemeinen und im besonderen nach den vorstehend beschriebenen Methoden.

25 Die für die Herstellung der Verbindungen I nach den vorstehend beschriebenen Verfahren benötigten Ausgangsstoffe der Formeln IIIa und IIIb sind aus der eingangs genannten Literatur bekannt oder können gemäß den dort beschriebenen Verfahren in analoger Weise hergestellt werden.

30

Die Ausgangsstoffe der Formel IIa können erhalten werden, indem man ein geeignet substituiertes Pyrimidin der Formel VIa in einem inerten Lösungsmittel in Gegenwart einer metallorganischen Base mit einer aktivierten Carbonsäure der Formel VIIa umsetzt

35 [vgl. J. Organomet. Chem. 56, 53-66 (1973); Chem. Ber. 125, 1169-1190 (1992)].



Y¹ in der Formel VIa steht für ein Halogenatom, z.B. Fluor, Chlor, Brom und Iod, besonders Brom und Iod.

L^3 in der Formel VII steht für ein Halogenatom, z.B. Fluor, Chlor, Brom und Iod, besonders Chlor, oder einen Amid- oder einen Esterrest. Anstelle der Verbindung VIIa kann auch ein entsprechendes Cyanid $R^2-C\equiv N$ eingesetzt werden.

5

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel in Gegenwart einer metallorganischen Base bei Temperaturen von -75°C bis 40°C , vorzugsweise -75°C bis 0°C .

- 10 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Diethylether und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

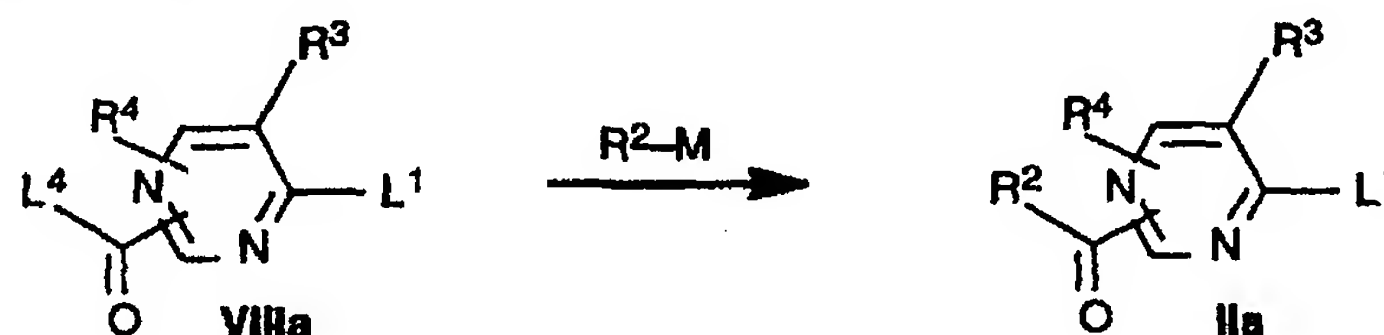
- 20 Als metallorganische Basen kommen allgemein metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie in Betracht. Besonders bevorzugt werden n-Butyllithium. Die Basen können im allgemeinen äquimolar oder im Überschuß verwendet werden.

25

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, VIIa in einem Überschuß bezogen auf VIa einzusetzen.

- 30 Nach einer weiteren Methode erhält man die Verbindungen IIa auch dadurch, daß man ein Pyrimidincarbonsäure-halogenid der allgemeinen Formel VIIa in einem inerten Lösungsmittel mit einer metallorganischen Verbindung (R^2-M ; M steht für das Äquivalent eines Metallions) umsetzt [vgl. DE-A 38 38 243; EP-A 446 872].

35



40

Als Metall (M) eignen sich besonders Lithium, Magnesium, Kupfer und Zink.

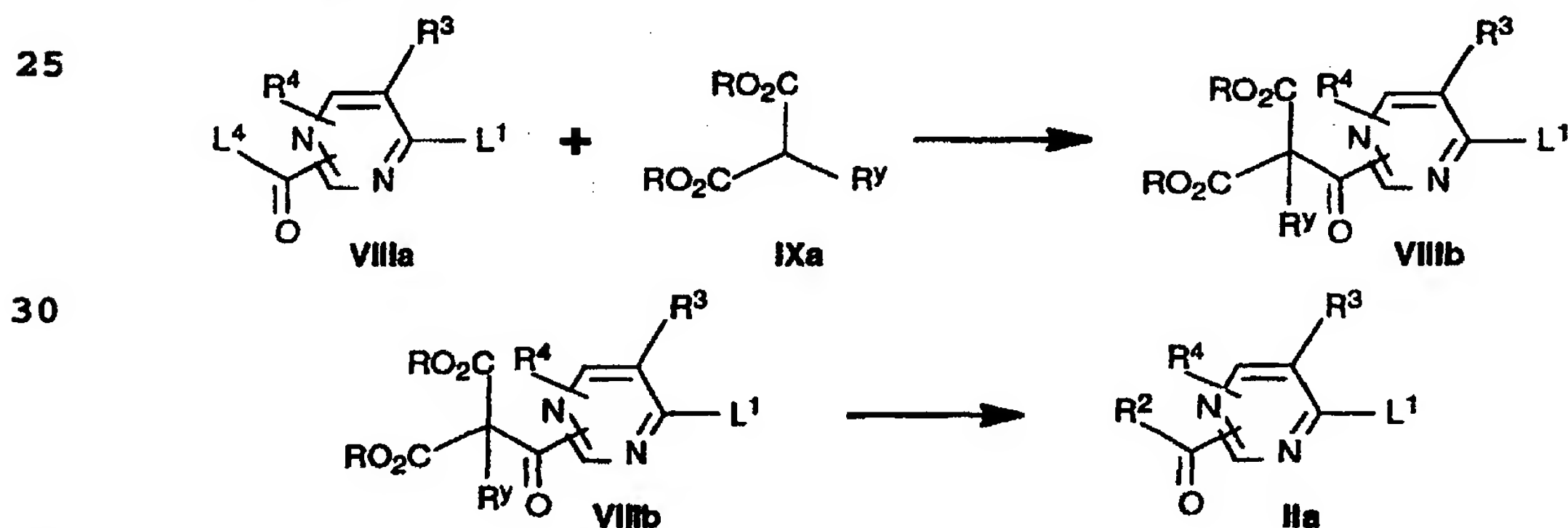
- 45 L^4 in der Formel VIIa steht für ein Halogenatom, z.B. Fluor, Chlor, Brom und Iod, besonders Chlor.

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von -80°C bis 20°C , vorzugsweise -75°C bis 0°C .

5 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, besonders bevorzugt Diethylether und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die 15 metallorganische Verbindung in einem Überschuß bezogen auf VIIIA einzusetzen.

Nach einer weiteren Methode erhält man die Verbindungen IIA auch dadurch, daß man ein Pyrimidincarbonsäure-halogenid der allgemeinen Formel VIIIA in einem inerten Lösungsmittel mit einem Malonsäureester der Formel IX in das entsprechende Triketon VIIIB überführt und VIIIB anschließend zu IIA umsetzt [vgl. Tetrahedron 48 (22), 9233 (1992)].



R^{Y} in den Formeln VIIIB und IXa steht für den Rest einer Gruppe R^2 .

R in den Formeln VIIIB und IXa steht für voneinander unabhängige 40 C_1 - C_4 -Alkylgruppen, insbesondere Methyl und Ethyl.

3a) Die Umsetzung von VIIIA und IXa erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von 0°C bis 120°C , vorzugsweise 20°C bis 80°C in Gegenwart einer Base und ggf. in Gegenwart einer Lewis-Säure wie Magnesiumchlorid. 45

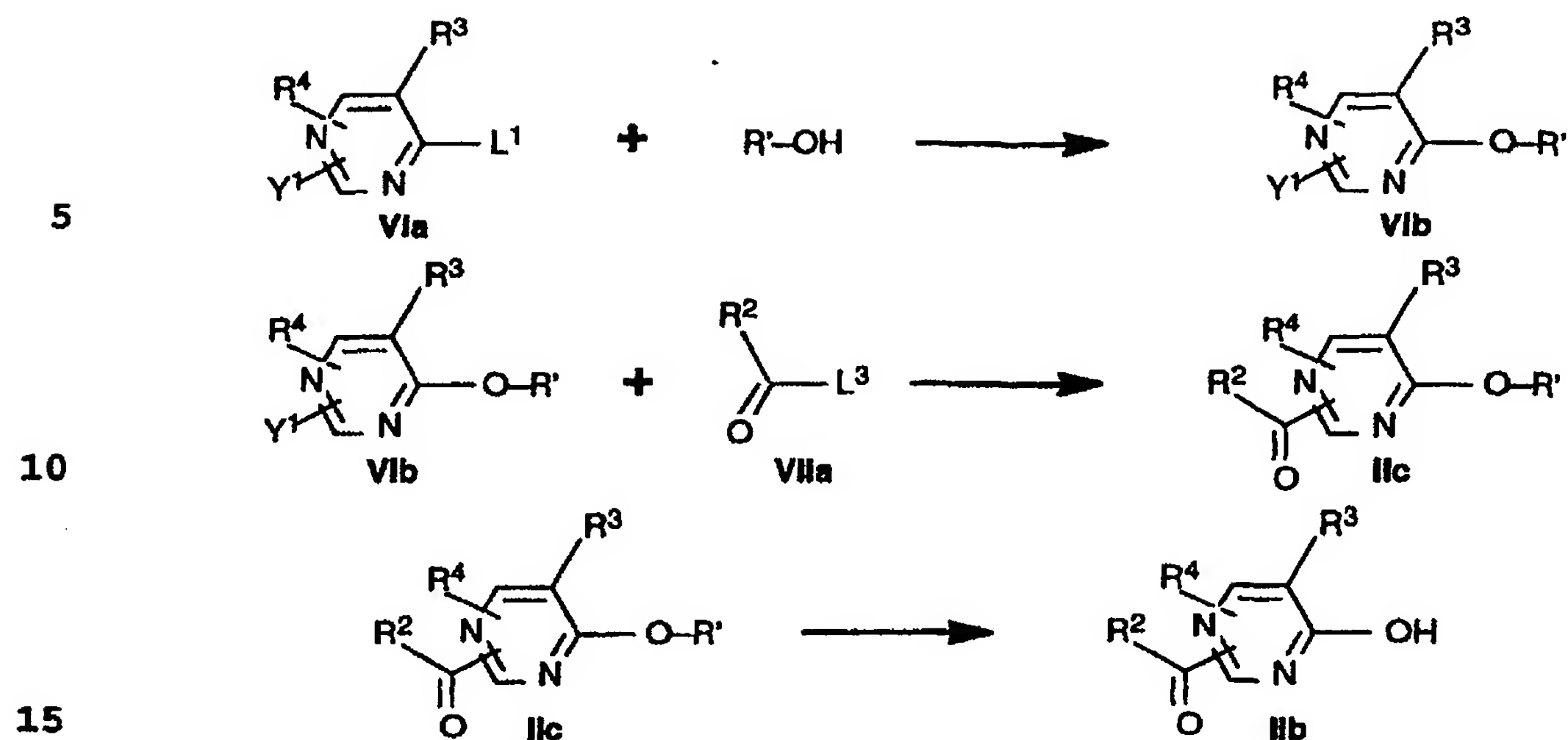
Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Toluol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kaliumtert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid und Triethylamin. Die Basen werden im allgemeinen äquimolar eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, IXa in einem Überschuß bezogen auf VIIla einzusetzen.

3b) Die Decarboxylierung von VIIb zu IIa erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von 60°C bis 200°C, vorzugsweise 100°C bis 160°C ggf. in Gegenwart einer Base.

- 5 Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Wasser und Dimethylsulfoxid. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 10 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und
- 15 Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogencarbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, Kalium-
- 20 tert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid und Natriummethanolat. Die
- 25 Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.
- 30
- 35 Die Ausgangsstoffe der Formel IIb erhält man dadurch, daß man ein geeignet substituiertes Pyrimidinderivat der Formel VIa in Gegenwart einer Base mit einem Alkoholat ($R'-O^- M^+$; R' bedeutet C_1-C_4 -Alkyl, M^+ steht für das Äquivalent eines Alkalimetall- oder Erdalkalimetall-kations, insbesondere Natrium oder Kalium) in
- 40 den entsprechenden Alkyl-pyrimidylether der Formel VIb überführt, VIb anschließend in Analogie zum vorstehend beschriebenen Verfahren (Umsetzung von VIa) durch Umsetzung mit einer aktivierten Carbonsäure der Formel VIIa in den entsprechenden Ether IIc überführt und IIc anschließend zu IIb spaltet.



4a) Die Veretherung von VIa zu VIb erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 120°C, vorzugsweise 20°C bis 80°C in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels.

20

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Dimethylformamid. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

30

Das Pyrimidinderivat VIa und das Alkoholat werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, das Alkoholat in einem Überschuß bezogen auf VIa oder als Lösungsmittel einzusetzen.

35

4b) Die Umsetzung des Ethers VIb mit der aktivierten Carbonsäure VIIa erfolgt im allgemeinen und im besonderen unter den bei der Herstellung der Verbindungen IIa aus den Verbindungen VIa beschriebenen Bedingungen.

40

4c) Die Etherspaltung von IIc nach IIb erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von 0°C bis 130°C, vorzugsweise 60°C bis 100°C in Gegenwart einer Säure.

45

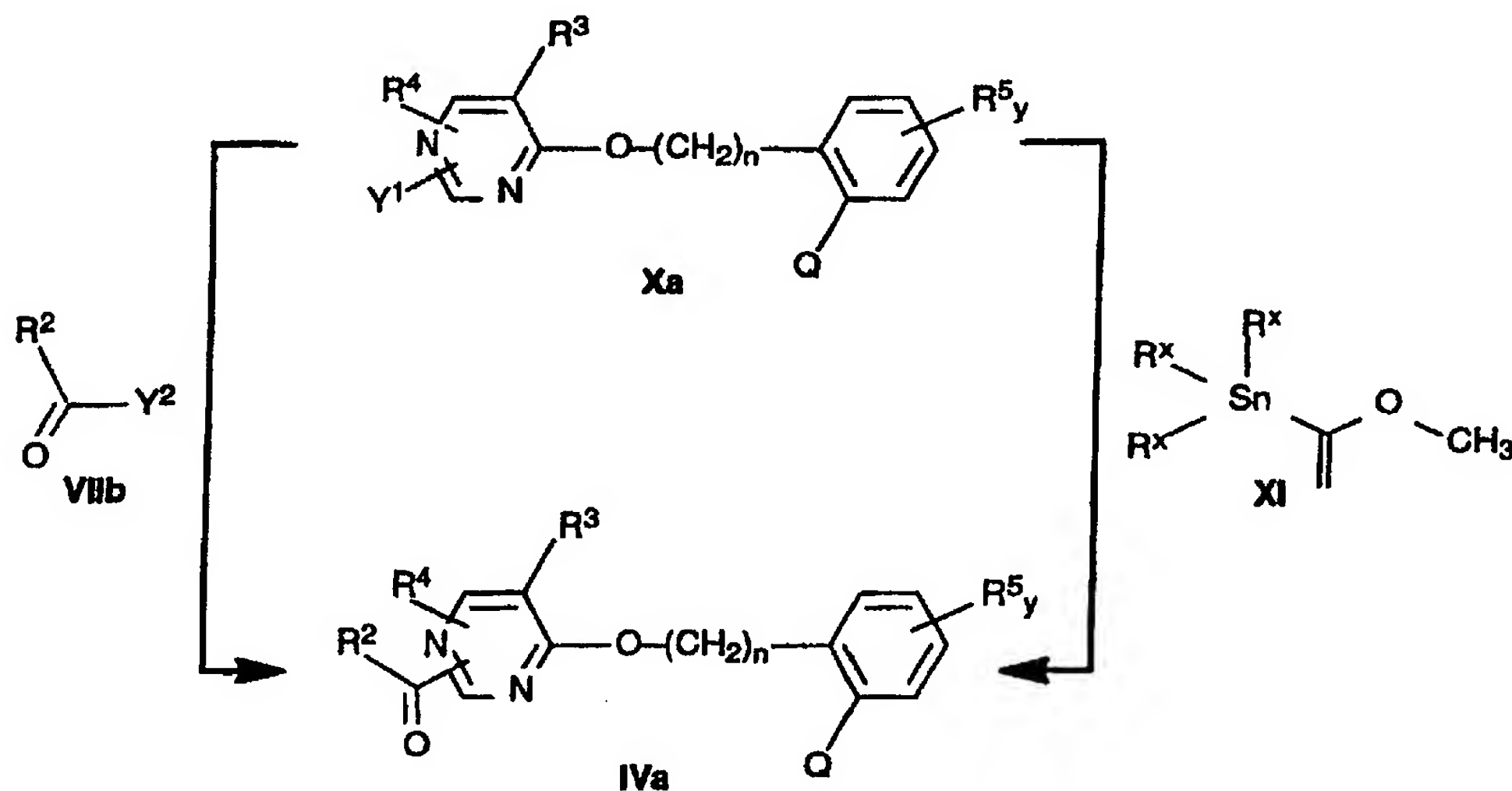
Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Methylenchlorid. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Säuren und saure Katalysatoren finden anorganische Säuren wie Fluorwasserstoffsäure, Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure und Perchlorsäure, Lewis-Säuren wie Bortrifluorid, Aluminiumtrichlorid, Eisen-III-chlorid, Zinn-IV-chlorid, Titan-IV-chlorid und Zink-II-chlorid, sowie organische Säuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Zitronensäure und Trifluoressigsäure Verwendung. Die Säuren werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Zwischenprodukte der Formel IVa können außerdem dadurch erhalten werden, daß man einen Ether der Formel Xa entweder

- in Gegenwart einer metallorganischen Base in einem inerten Lösungsmittel mit einer aktivierten Carbonsäure der Formel VIIb oder
- in einem inerten Lösungsmittel mit einer Zinn-organischen Verbindung der Formel XI

umsetzt.



Y^1 in der Formel Xa steht für ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere Brom und Iod.

Y^2 in der Formel VIIb steht für ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere Chlor.

Die Reste R^* in der Formel XI sind voneinander unabhängig und stehen für Alkyl.

10 5a) Die Umsetzung des Ethers Xa mit der aktivierten Carbonsäure VIIb erfolgt im allgemeinen und im besonderen unter den bei der Herstellung der Verbindungen IIa aus den Verbindungen VIa beschriebenen Bedingungen.

15 5b) Die Umsetzung des Ethers Xa mit der Zinn-organischen Verbindung XI erfolgt üblicherweise in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen von -70°C bis 40°C , vorzugsweise -70°C bis 0°C in Gegenwart eines Katalysators wie $\text{Pd}[\text{P}(\text{C}_6\text{H}_5)_3]_3$ und PdCl_2 .

20

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Tetrahydrofuran und Diethylether. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

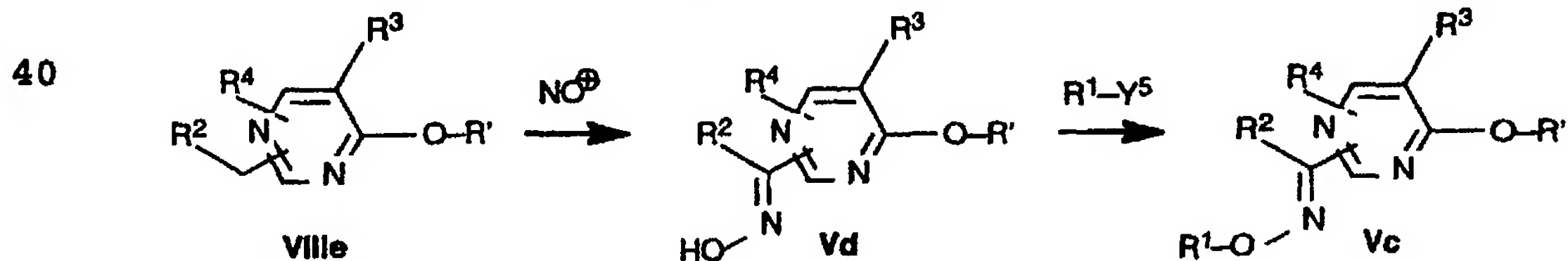
25

30

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Zinn-organische Verbindung XI in einem Überschuß bezogen auf den Ether Xa einzusetzen.

35

Die Zwischenprodukte der Formel Vc erhält man bevorzugt dadurch, daß man einen Alkyl-pyrimidylether VIIle zu Vd nitrosiert und Vd anschließend mit einem Reagens R^1-Y^5 zu Vc umsetzt.



45

Y^5 steht für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe wie Halogen (z.B. Fluor, Chlor, Brom oder Iod) oder Alkyl- oder Arylsulfonat (z.B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfonat, Phenylsulfonat oder Methylphenylsulfonat).

5

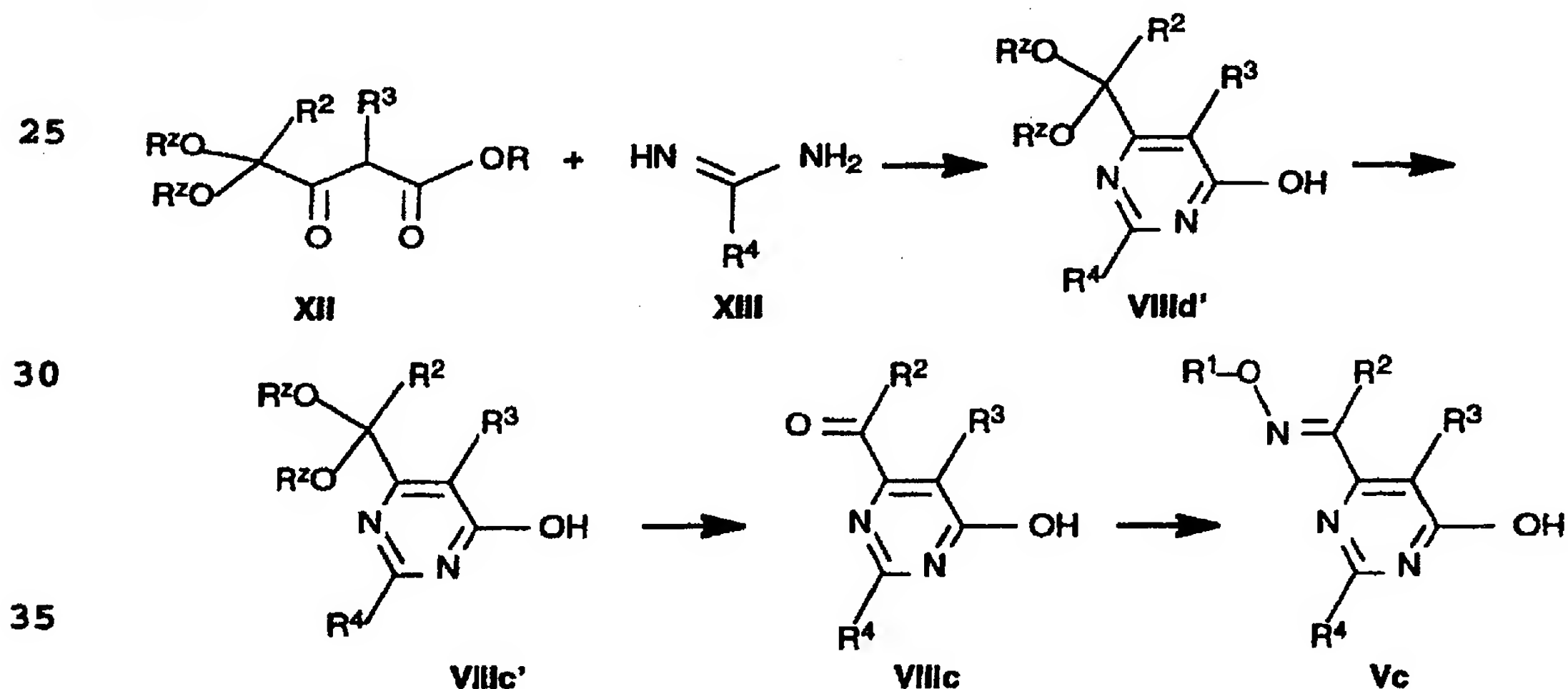
6a) Die Nitrosierung von VIIIe nach Vd erfolgt üblicherweise im allgemeinen und im besonderen gemäß den in der Literatur beschriebenen Methoden [vgl. Houben-Weyl, E14b, Teil 1, Seite 287 f. und Liebigs Ann. Chem. 737, 39 (1970)].

10

6b) Die Veretherung von Vd nach Vc erfolgt üblicherweise im allgemeinen und im besonderen gemäß den in der Literatur beschriebenen Methoden [vgl. Houben-Weyl, E14b, Teil 1, Seite 370 f.].

15

Nach einem weiteren bevorzugten Verfahren erhält man die Verbindungen Vc dadurch, daß man ein β -Dicarbonyl der Formel XII mit einem Amidin, Guanidin, Harnstoff oder Thioharnstoff der Formel XIII in das entsprechende Pyrimidin VIIId' überführt, VIIId' zum Keton VIIIc hydrolysiert und VIIIc anschließend mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz zu I umsetzt.



R in der Formel XII bedeutet einen Alkylrest mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, vorzugsweise Methyl oder Ethyl.

40

R^2 in den Formeln XII, VIIId' und VIIIc' steht für Alkylgruppen, bevorzugt mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Methyl und Ethyl; die beiden Gruppen R^2 können auch gemeinsam für eine Ethylen- oder Propylenkette stehen.

45

- 7a) Die Umsetzung von XII mit XIII wird üblicherweise bei Temperaturen von 0 bis 120°C, vorzugsweise 20 bis 80°C und insbesondere bei der Siedetemperatur des Lösungsmittels durchgeführt. Als Lösungsmittel finden üblicherweise Alkohole, insbesondere Methanol oder Ethanol, Verwendung.

Die Verbindungen XIII können auch in Form ihrer Salze, insbesondere als Hydrohalogenide (z.B. Hydrochlorid oder Hydrobromid) eingesetzt werden. Bei der Verwendung von Salzen empfiehlt es sich, die Umsetzung in Gegenwart einer Base durchzuführen (z.B. Erdalkalimetall- oder Alkalimetallalkoholate oder -hydroxide wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kalium-tert.-nutyilat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid).

- 7b) Die Hydrolyse von VIIId zu VIIIf erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 130°C, vorzugsweise 20°C bis 110°C in einem inerten Lösungsmittel in Gegenwart einer Säure.
- Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Dioxan. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Säuren und saure Katalysatoren finden anorganische Säuren wie Fluorwasserstoffsäure, Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure und Perchlorsäure, Lewis-Säuren wie Bortrifluorid, Aluminiumtrichlorid, Eisen-III-chlorid, Zinn-IV-chlorid, Titan-IV-chlorid und Zink-II-chlorid, besonders bevorzugt Salzsäure, sowie organische Säuren wie Ameisensäure, Essigsäure, Propionsäure, Oxalsäure, Zitronensäure und Trifluoressigsäure Verwendung. Die Säuren werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

7c) Die Oximierung von VIIIC nach Vc erfolgt im allgemeinen und im besonderen gemäß den vorstehend für die Herstellung von I aus IVb im Punkt 2b) beschriebenen Bedingungen.

5 Im allgemeinen ist es bei der Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen I unerheblich, ob die den Phenyl- bzw. Benzylteil enthaltenden Edukte und Zwischenprodukte (Formeln III, IV und X) sowie bei den Ethern der Formel I bereits die Gruppe Q enthalten oder ob in dieser Position eine Gruppe steht, die nach
10 den in der eingangs zitierten Literatur beschriebenen Verfahren in Q überführt werden kann. Die Gruppe Q kann grundsätzlich auf jeder der genannten Stufen (Formeln III, IV, X und I) aufgebaut werden.

15 In den neuen Zwischenprodukten allgemeinen Formel II



haben die Substituenten R², R³ und R⁴ und der Index x die eingangs gegebene Beutung haben und L und Z stehen für die folgenden Gruppen:

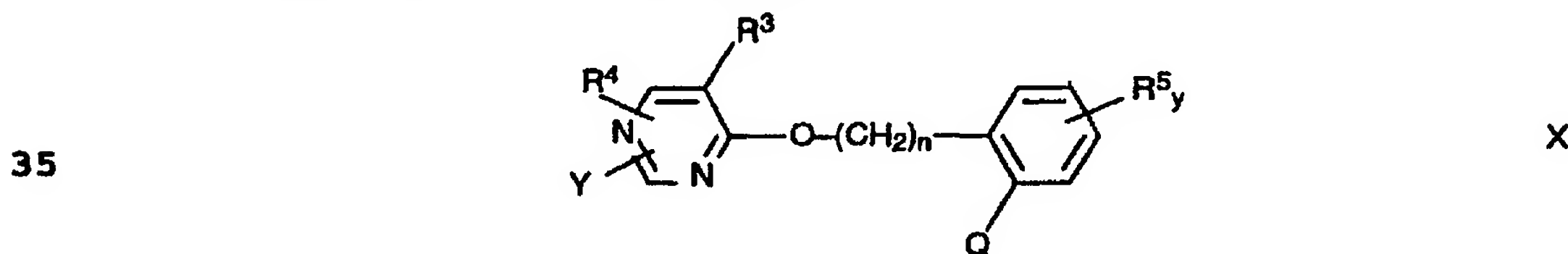
25

L Hydroxy oder eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe;

Z Sauerstoff oder eine Gruppe NOR¹, wobei R¹ die eingangs gegebene Bedeutung hat.

30

In den neuen Zwischenprodukten allgemeinen Formel X



haben die Substituenten Q, R², R³, R⁴ und R⁵ und die Indices n, x und Y die eingangs gegebene Beutung haben und Y steht für die
40 folgenden Gruppen: Halogen oder CO-R², wobei R² die eingangs gegebene Bedeutung hat.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder
45 schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck

und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

5

Die Verbindungen I können bei der Herstellung aufgrund ihrer C=C- und C=N-Doppelbindungen als E/Z-Isomerengemische anfallen, die z.B. durch Kristallisation oder Chromatographie in üblicher Weise in die Einzelverbindungen getrennt werden können.

10

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz oder tierischen Schädling erfolgen.

20

In Bezug auf die C=NOR¹-Doppelbindung werden hinsichtlich ihrer Wirksamkeit die E-Isomere der Verbindungen I bevorzugt (Konfiguration bezogen auf die R²-Gruppe im Verhältnis zur OR¹-Gruppe).

25 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

30

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlorme-

thyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-
5 2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein
10 Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Halogenalkoxy: geradkettige oder verzweigte Halogenalkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

15

Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

20 **Alkylamino:** eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden ist;

Dialkylamino: zwei voneinander unabhängige geradkettige oder
25 verzweigte Alkylgruppen mit jeweils 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Stickstoffatom an das Gerüst gebunden sind;

Alkylcarbonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit
30 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkoxycarbonyl: eine Alkoxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-)
35 an das Gerüst gebunden ist;

Alkylthiocarbonyl: eine Alkylthiogruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

40

Alkylaminocarbonyl: eine Alkylaminogruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

45

Dialkylaminocarbonyl: eine Dialkylaminogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 5 **Alkylcarbonyloxy:** eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst gebunden ist;
Alkylcarbonylthio: eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche
10 über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkylcarbonylamino: eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylaminogruppe (-CONH-) an das Gerüst ge-
15 bunden ist;

Alkylsulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;
20

Alkoxysulfonyl: eine Alkoxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- 25 **Alkylthiosulfonyl:** eine Alkylthiogruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkylaminosulfonyl: eine Alkylaminogruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;
30

Dialkylaminosulfonyl: eine Dialkylaminogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst
35 gebunden ist;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B.

- 40 C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl,
45 tenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl,

1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl,
3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl,
2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl,
1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl,
5 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl,
3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl,
2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl,
1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-
1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl,
10 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-
3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl,
2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dime-
thyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl,
1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Eth-
15 yl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,
1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und
1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Koh-
20 lenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend ge-
nannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise
oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, ins-
besondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

25

Alkenyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlen-
wasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dop-
pelbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbar-
ten, Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauer-
30 stoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Halogenalkenyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte
Alkenyloxygruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend
35 genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise
oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, ins-
besondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkenylthio: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlen-
wasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dop-
40 pelbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbar-
ten, Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwe-
felatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkenylamino: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlen-
45 wasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dop-
pelbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbar-

ten, Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Amino-
gruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkenylcarbonyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Koh-
5 lenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend ge-
nannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst ge-
bunden sind;

10 Alkenyloxycarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkenyloxygrup-
pen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt),
welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden
sind;

15 Alkenylthiocarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkenylthio-
gruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt),
welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden
sind;

20 Alkenylaminocarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkenylamino-
gruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt),
welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden
sind;

25 Alkenylcarbonyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte
Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend ge-
nannt), welche über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst
gebunden ist;

30

Alkenylcarbonylthio: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte
Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend ge-
nannt), welche über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Ge-
35 rüst gebunden ist;

Alkenylcarbonylamino: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte
Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend ge-
40 nannt), welche über eine Carbonylaminogruppe (-CONH-) an das Ge-
rüst gebunden ist;

Alkenylsulfonyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Koh-
lenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
45 Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend ge-

nannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

Alkenyloxysulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkenyl-
5 oxygruppe mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

Alkenylthiosulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkenyl-
10 thiogruppe mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

Alkenylaminosulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkenyl-
15 aminogruppe mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen
20 mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C_2 - C_6 -Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-
25 butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,
30 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Halogenalkinyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer
35 Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;
40

Alkinyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbar-
45 ten, Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom ($-\text{O}-$) an das Gerüst gebunden sind;

Halogenalkinyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Alkinyloxygruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkinylothio: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbarten, Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinylamino: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbarten, Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinylcarbonyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinyloxycarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkinyloxygruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinylothiocarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkinylothiogruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinylaminocarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkinylaminogruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkinylcarbonyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkynylcarbonylthio: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkynylcarbonylamino: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylaminogruppe (-CONH-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkynylsulfonyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkynyloxysulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkynyloxygruppe mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkynylthiosulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkynylthiogruppe mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Alkynylaminosulfonyl: eine geradkettige oder verzweigte Alkynylaminogruppe mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6, 8, 10 oder 12 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

Cycloalkoxy: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Cycloalkylthio: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

5

Cycloalkylamino: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden sind;

10

Cycloalkylcarbonyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden sind;

15

Cycloalkoxycarbonyl: eine monocyclische Cycloalkoxygruppe mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

20 Cycloalkylthiocarbonyl: eine monocyclische Cycloalkylthiogruppe mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

25 Cycloalkylaminocarbonyl: eine monocyclische Cycloalkylamino-
gruppe mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

30 Cycloalkylcarbonyloxy: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst gebunden sind;

35 Cycloalkylcarbonylthio: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden sind;

40 Cycloalkylcarbonylamino: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylaminogruppe (-CONH-) an das Gerüst gebunden sind;

45

Cycloalkylsulfonyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden sind;

5

Cycloalkoxysulfonyl: eine monocyclische Cycloalkoxygruppe mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

10 **Cycloalkylthiosulfonyl:** eine monocyclische Cycloalkylthiogruppe mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

Cycloalkylaminosulfonyl: eine monocyclische Cycloalkylamino-
15 gruppe mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe ($-\text{SO}_2-$) an das Gerüst gebunden ist;

gesättigtes oder partiell ungesättigter cyclischer Rest, welcher
20 neben Kohlenstoffatomen als Ringglieder Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff enthalten kann:
Cycloalkyl mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern wie vorstehend genannt oder 5- oder 6-gliedrige Heterocyclen (Heterocyclyl) enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stick-
25 stoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isouthiazolidinyl, 4-Isouthiazolidinyl,
30 lidinyl, 5-Isouthiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2,3-Pyrrolin-2-yl, 2,3-Pyrrolin-3-yl, 2,4-Pyrrolin-2-yl, 2,4-Pyrrolin-3-yl, 2,3-Isloxazolin-3-yl, 3,4-Isloxazolin-3-yl, 4,5-Isloxazolin-3-yl, 2,3-Isloxazolin-4-yl, 3,4-Isloxazolin-4-yl, 4,5-Isloxazolin-4-yl, 2,3-Isloxazolin-5-yl, 3,4-Isloxazolin-5-yl, 4,5-Isloxazolin-5-yl, 2,3-Isouthiazolin-3-yl, 3,4-Isouthiazolin-3-yl, 4,5-Isouthiazolin-3-yl, 2,3-Isouthiazolin-4-yl, 3,4-Isouthiazolin-4-yl, 4,5-Isouthiazolin-4-yl, 2,3-Isouthiazolin-5-yl, 3,4-Isouthiazolin-5-yl, 4,5-Isouthiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropy-

razol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl, 2-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl;

15

Heterocyclyloxy: ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden ist;

20 **Heterocyclylthio:** ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden ist;

Heterocyclylamino: ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden ist;

25 **Heterocyclylcarbonyl:** ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

30 **Heterocyclyloxycarbonyl:** eine Heterocyclyloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

35

Heterocyclylthiocarbonyl: eine Heterocyclylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

40 **Heterocyclylaminocarbonyl:** ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welche über eine Aminocarbonylgruppe (-NHCO-) an das Gerüst gebunden ist;

Heterocyclylcarbonyloxy: ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

45

Heterocyclylcarbonylthio: ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden ist;

5 **Heterocyclylcarbonylamino:** ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie vorstehend genannt), welcher über eine Carbonylaminogruppe (-CONH-) an das Gerüst gebunden ist;

Heterocyclylsulfonyl: ein 5- oder 6-gliedriger Heterocyclus (wie
10 vorstehend genannt), welcher über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Aryloxysulfonyl: eine Heterocyclyloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst
15 gebunden ist;

Heterocyclylthiosulfonyl: eine Heterocyclylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welcher über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;
20

Heterocyclylaminosulfonyl: eine Heterocyclylaminogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

25 **Aryl:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem enthaltend 6 bis 14 Kohlenstoffringglieder, z.B. Phenyl, Naphthyl und Anthracenyl;

Aryloxy: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie
30 vorstehend genannt), welches über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden ist;

Arylthio: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über ein Schwefelatom (-S-) an das
35 Gerüst gebunden ist;

Arylamino: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden ist;
40

Arylcarbonyl: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

45

Aryloxycarbonyl: eine ein- bis dreikernige Aryloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 5 **Arylthiocarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 10 **Arylaminocarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylaminogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 15 **Arylcarbonyloxy:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Arylcarbonylthio: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden ist;

- 20 **Arylcarbonylamino:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylamino-Gruppe (-CONH-) an das Gerüst gebunden ist;

- 25 **Arylsulfonyl:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- 30 **Aryloxysulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Aryloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- 35 **Arylthiosulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- Arylaminosulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylaminogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- 40 **aromatisches Ringsystem,** welches neben Kohlenstoffringgliedern Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann: Aryl wie vorstehend genannt oder ein- oder zweikerniges Heteroaryl, z.B.

- 45 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei

- Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isotiazolyl, 4-Isotiazolyl, 5-Isotiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 5 - benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroarvl. enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein
- 15 bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;
- 20 - über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroarvl. enthaltend ein bis vier Stickstoffatome, oder über Stickstoff gebundenes benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroarvl. enthaltend ein bis drei Stickstoffatome: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome bzw. ein bis
- 25 drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können, wobei diese Ringe über eines der Stickstoffringglieder an das Gerüst
- 30 gebunden sind;
- 35 - 6-gliedriges Heteroarvl. enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

Hetaryloxy: ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ring-
40 system (wie vorstehend genannt), welches über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden ist;

Hetarylthio: ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ring-
system (wie vorstehend genannt), welches über ein Schwefelatom
45 (-S-) an das Gerüst gebunden ist;

Hetarylamino: ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden ist;

- 5 **Hetarylcarbonyl:** ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 10 **Hetaryloxycarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Hetaryloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 15 **Hetarylthiocarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Hetarylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

- 20 **Hetarylaminocarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Hetarylamino-
gruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

Hetarylcarbonyloxy: ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonyloxygruppe (-CO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- 25 **Hetarylcarbonylthio:** ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden ist;

- 30 **Hetarylcarbonylamino:** ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylaminogruppe (-CONH-) an das Gerüst gebunden ist;

- 35 **Hetarylsulfonyl:** ein ein- bis dreikerniges heteroaromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- 40 **Hetaryloxysulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Hetaryloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

- Hetarylthiosulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Hetarylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

Hetarylaminosulfonyl: eine ein- bis dreikernige Hetarylamino-
gruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe
(-SO₂-) an das Gerüst gebunden ist;

5 **Alkylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH₂-Gruppen,
z.B. CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;

Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Grup-
pen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst ge-
10 bunden ist, z.B. OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂;

Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3
CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das
Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O;

15

Alkenylen: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen
und einer CH=CH-Gruppe in einer beliebigen Position, z.B.
CH=CHCH₂, CH₂CH=CHCH₂, CH=CHCH₂CH₂, CH₂CH=CHCH₂CH₂ und
CH=CHCH₂CH₂CH₂;

20

Oxyalkenylen: divalente unverzweigte Ketten aus 0 bis 2
CH₂-Gruppen und einer CH=CH-Gruppe in einer beliebigen Posi-
tion, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst
gebunden ist, z.B. OCH=CH, OCH=CHCH₂, OCH₂CH=CH, OCH₂CH=CHCH₂,
25 OCH=CHCH₂CH₂ und OCH₂CH₂-CH=CH;

Oxyalkenylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 0 bis 2
CH₂-Gruppen und einer CH=CH-Gruppe in einer beliebigen Posi-
tion, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst
30 gebunden ist, z.B. OCH=CHO, OCH=CHCH₂O, OCH₂CH=CHCH₂O und
OCH=CHCH₂CH₂O;

organischer Rest: ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkinyll, Cyclo-
alkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Hetaryl.

35

Der Zusatz "ggf. subst." in Bezug auf Alkyl-, Alkenyl- und
Alkinyllgruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen par-
tiell oder vollständig halogeniert sein können [d.h. die Wasser-
stoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig
40 durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend ge-
nannt (vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom) ersetzt sein] und/
oder einen bis drei (vorzugsweise einen) der folgenden Reste
tragen können:

- Cyano, Nitro, Hydroxy, Amino, Formyl, Carboxyl, Aminocarbonyl,
45 Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkyl-
amino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkyl-
carbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkyl-

carbonylamino, Alkoxy-carbonylamino, Alkylcarbonyl-N-alkylamino und Alkylcarbonyl-N-alkylamino, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;

- 5 - unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkyl-N-alkylamino, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, Heterocyclylthio, Heterocyclylamino oder Heterocyclyl-N-alkylamino, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 12 Ringglieder, vorzugsweise 2 bis 8 Ringglieder, insbesondere 3 bis 6 Ringglieder
- 10 enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;
- unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes
- 15 Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-N-alkylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylamino, Arylalkyl-N-alkylamino, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, Hetarylamino, Hetaryl-N-alkylamino, Hetarylalkoxy, Hetarylalkylthio, Hetarylalkylamino und Hetarylalkyl-N-alkylamino, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, insbesondere 6 Ringglieder
- 20 (Phenyl) enthalten, die Hetarylreste insbesondere 5 oder 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten.
- 25
- Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf die cyclischen (gesättigten, ungesättigten oder aromatischen) Gruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können [d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können
- 30 teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere Fluor oder Chlor) ersetzt sein] und/oder einen bis vier (insbesondere einen bis drei) der folgenden Reste tragen können:
- 35 - Cyano, Nitro, Hydroxy, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Haloalkenyl, Alkenyloxy, Haloalkenyloxy, Alkynyl, Haloalkynyl, Alkinyloxy, Haloalkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylcarbonylamino, Alkoxy-carbonylamino, Alkylcarbonyl-N-alkylamino und Alkylcarbonyl-N-alkylamino, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8, vorzugsweise 2 bis 6, insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;
- 40
- 45

und/oder einen bis drei (insbesondere einen) der folgenden Reste:

- unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkyl-N-alkylamino, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, Heterocyclylamino oder Heterocyclyl-N-alkylamino, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 12 Ringglieder, vorzugsweise 2 bis 8 Ringglieder, insbesondere 3 bis 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;
- unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-N-alkylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylamino, Arylalkyl-N-alkylamino, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, Hetarylamino, Hetaryl-N-alkylamino, Hetarylalkoxy, Hetarylalkylthio, Hetarylalkylamino und Hetarylalkyl-N-alkylamino, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, insbesondere 6 Ringglieder (Phenyl) enthalten, die Hetarylreste insbesondere 5 oder 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen oder zwei (insbesondere einen) der folgenden Reste tragen kann:

- Formyl,
- $CR^{III}=NOR^{IV}$ [wobei R^{III} Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl und Aryl und R^{IV} Alkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkynyl und Arylalkyl bedeutet (wobei die genannten Alkylgruppen vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome, enthalten, die genannten Cycloalkylgruppen, Alkenylgruppen und Alkynylgruppen vorzugsweise 3 bis 8, insbesondere 3 bis 6, Kohlenstoffatome enthalten) und Aryl insbesondere Phenyl bedeutet, welches unsubstituiert ist oder durch übliche Gruppen substituiert sein kann] oder
- $NR^V-CO-D-R^{VI}$ [wobei R^V für Wasserstoff, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_6 -Alkynyloxy, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkoxy und C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl steht, R^{VI} für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, Aryl, Aryl- C_1 - C_6 -alkyl, Hetaryl und Hetaryl- C_1 - C_6 -alkyl steht und D eine direkte Bindung, Sauerstoff oder Stickstoff bedeutet, wobei der Stickstoff eine der bei R^{VI} genannten Gruppen tragen kann],

und/oder bei denen zwei benachbarte C-Atome der cyclischen Systeme eine C_3 - C_5 -Alkylen-, C_3 - C_5 -Alkenylen-, Oxy- C_2 - C_4 -alkylen-, Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy, Oxy- C_2 - C_4 -alkenylen-, Oxy- C_2 - C_4 -alkenylenoxy- oder Butadiendiylgruppe tragen können, wobei

diese Brücken ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei, insbesondere einen oder zwei der folgenden Reste tragen können:

- 5 - C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy und C₁-C₄-Alkylthio.

Unter üblichen Gruppen sind insbesondere die folgenden Substituenten zu verstehen: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylamino, Di-C₁-C₄-Alkylamino und C₁-C₄-Alkylthio.

Besonders bevorzugt werden Verbindungen I, in denen Q für C(CO₂CH₃)=CHCH₃, C(CO₂CH₃)=CHOCH₃, C(CO₂CH₃)=NOCH₃, C(CONHCH₃)=NOCH₃ oder N(OCH₃)-CO₂CH₃ steht.

15

Besonders bevorzugt sind auch Verbindungen der Formel I, in denen R¹ für Wasserstoff oder eine der folgenden Gruppen steht: ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Heteroaryl.

20

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für ggf. subst. C₁-C₆-Alkyl steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für ggf. subst. C₃-C₆-Alkenyl steht.

25

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für ggf. subst. C₃-C₆-Alkynyl steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₆-Halogenalkyl steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₆-Halogenalkenyl steht.

35

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für Aryl-C₁-C₂-alkyl steht, wobei der Arylrest gegebenenfalls substituiert sein kann.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für Aryl-C₁-C₂-alkyl steht, wobei der Arylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl und C₁-C₄-Alkoxy.

45

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₂-alkyl steht, wobei der Cycloalkylrest gegebenenfalls substituiert sein kann.

5 Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₂-alkyl steht, wobei der Cycloalkylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei C₁-C₄-Alkylgruppen tragen kann.

10 Desweiteren werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für Hetaryl-C₁-C₂-alkyl steht, wobei der Hetarylrest gegebenenfalls substituiert sein kann.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für Heta-
15 ryl-C₁-C₂-alkyl steht, wobei der Hetarylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl und C₁-C₄-Alkoxy.

20 Außerdem werden Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen R² für Wasserstoff oder eine der folgenden Gruppen steht: ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Gruppen direkt (über ein Kohlenstoff-Atom) oder über ein Sauerstoff-, Schwefel- oder
25 Stickstoff-Atom an das Gerüst gebunden sind.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² für ggf. subst. C₁-C₆-Alkyl steht.

30 Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R² für ggf. subst. C₂-C₆-Alkenyl steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für ggf. subst. C₂-C₆-Alkynyl steht.

35

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R² für C₃-C₆-Cycloalkyl steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R²
40 für Aryl steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R² für Hetaryl steht.

45

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^3 für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_3 -Alkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkyl, insbesondere Wasserstoff, Methyl, Fluor, Chlor, Ethyl, Isopropyl und Trifluormethyl, steht.

5

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^3 für Wasserstoff steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^3
10 für Halogen, insbesondere Fluor, Chlor und Brom steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^3 für Methyl steht.

15 Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^3 für C_1 -Halogenalkyl, insbesondere Trifluormethyl, steht.

Desweiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für Wasserstoff steht.

20

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für Halogen, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^4
25 für C_1 - C_2 -Alkyl steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R^4 für C_1 - C_2 -Alkoxy steht.

30 Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^4 für Cyano steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für Nitro steht.

35

Desweiteren werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen y für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Reste R^5 verschieden sein können, wenn y für 2 oder 3 steht.

40 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen y für 0 oder 1 steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R^5 Cyano, Halogen, C_1 - C_3 -Alkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_3 -Al-
45 koxy, insbesondere Cyano, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Isopropyl, Trifluormethyl, Methoxy oder Ethoxy, bedeutet.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R⁵ für Methyl steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R⁵ für Methoxy steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R⁵ für Fluor steht.

10 Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R⁵ für Chlor steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R⁵ für Trifluormethyl steht.

15

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R⁵ für OCH₂O steht.

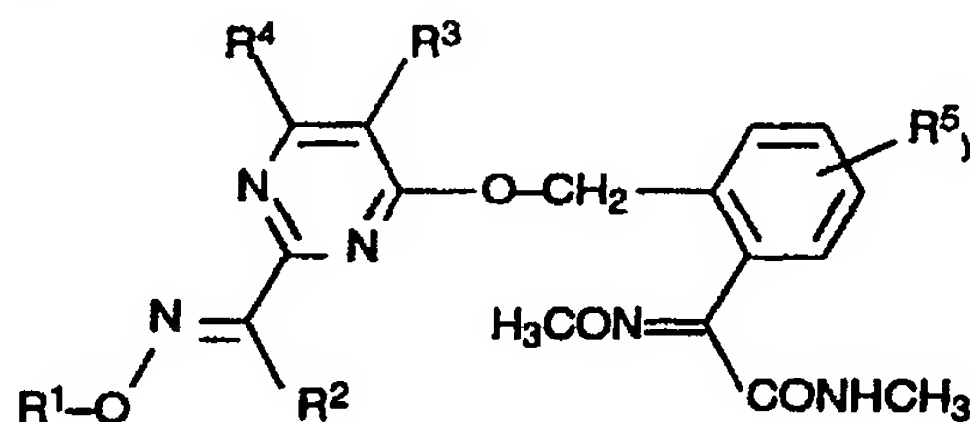
Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den
20 folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

25

Tabelle 1

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.1, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der
30 Tabelle A entspricht

35



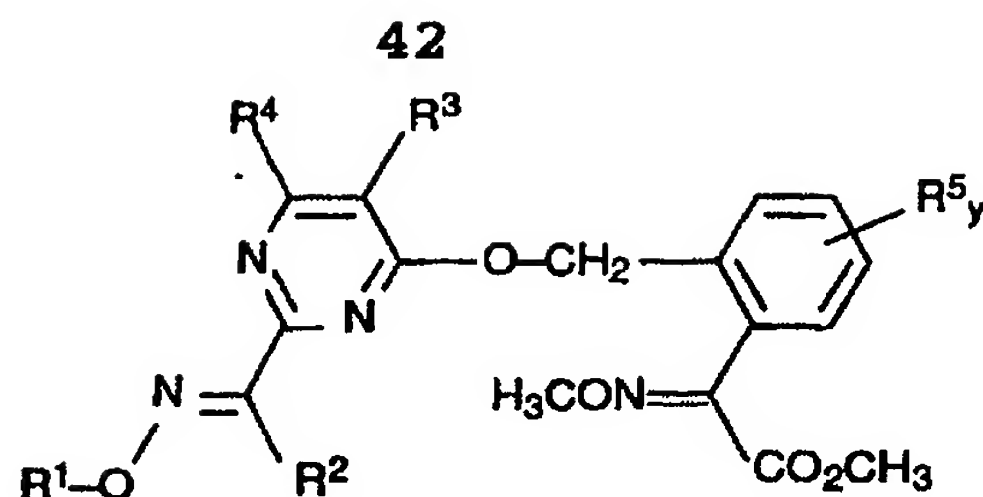
IA.1

Tabelle 2

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.2, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der
40 Tabelle A entspricht

45

5

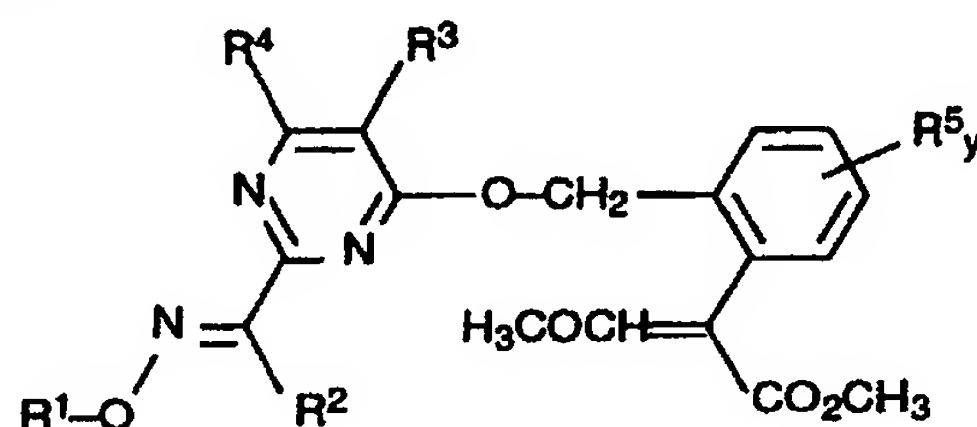


IA.2

Tabelle 3

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.3, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15



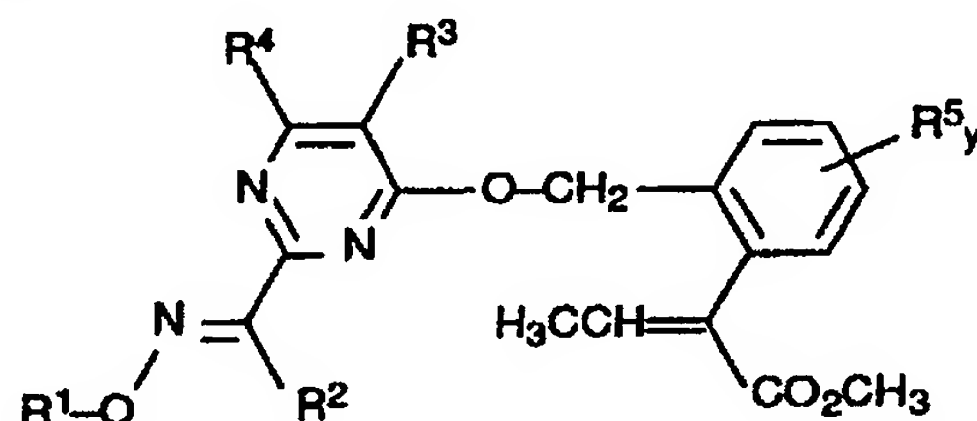
IA.3

20

Tabelle 4

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.4, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25



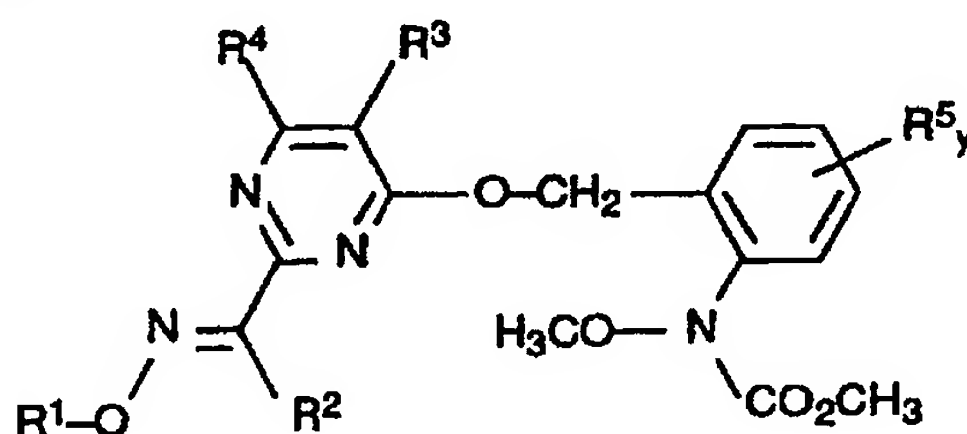
IA.4

30

Tabelle 5

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.5, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

40



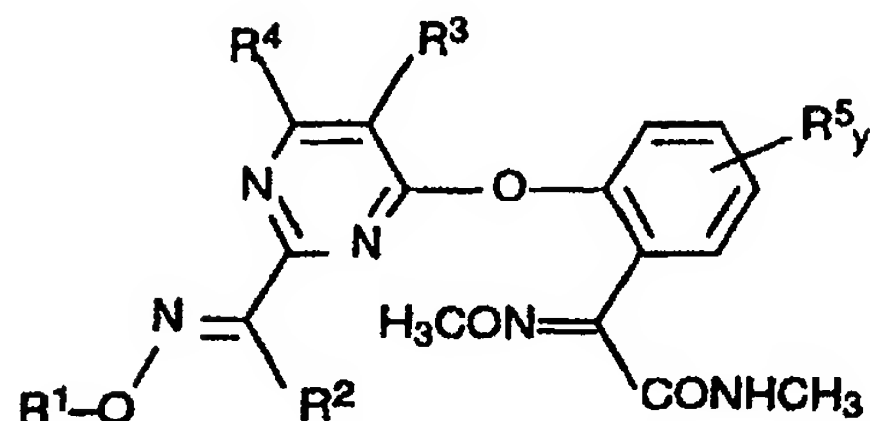
IA.5

Tabelle 6

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.6, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

stoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5



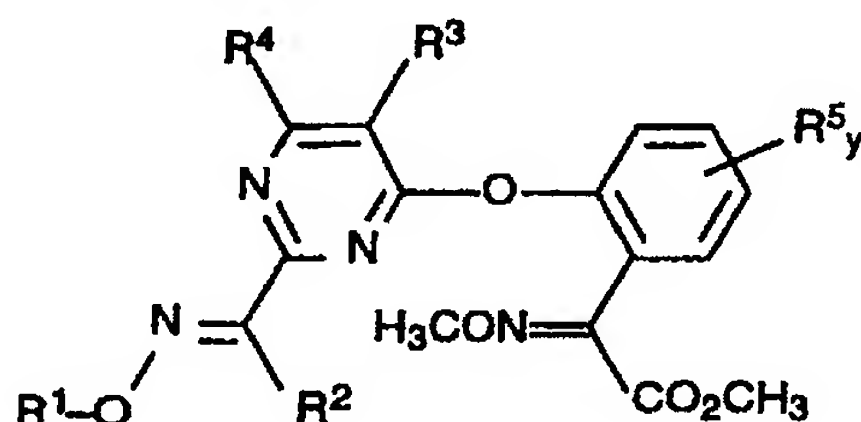
IA.6

10

Tabelle 7

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.7, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15



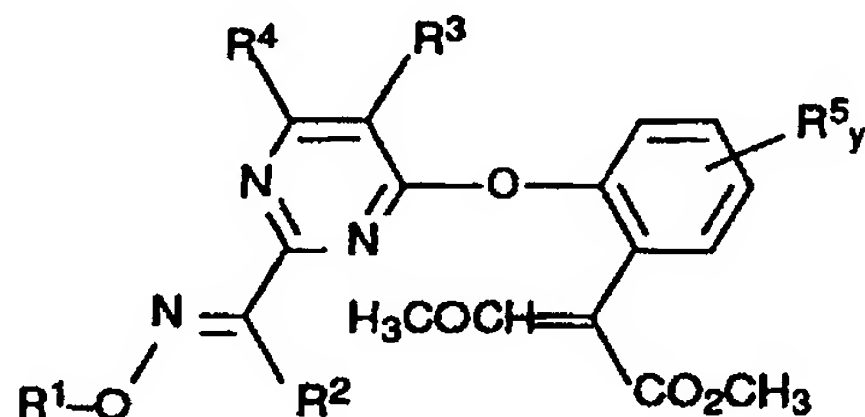
IA.7

20

Tabelle 8

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.8, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25



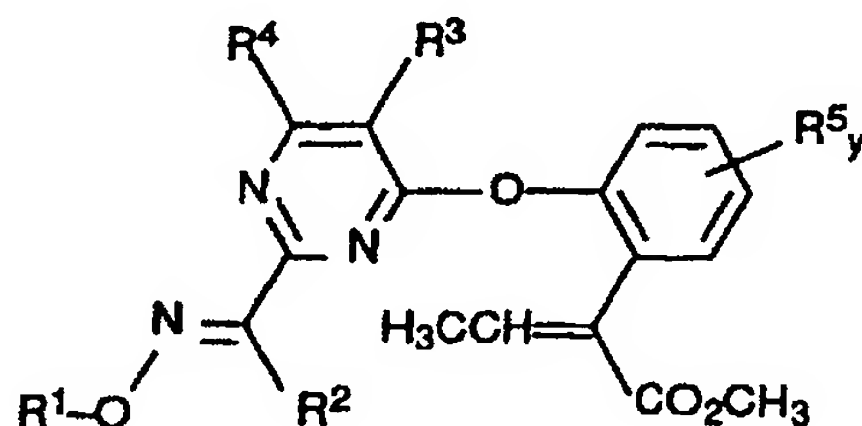
IA.8

30

Tabelle 9

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.9, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^{5y} für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

35



IA.9

40

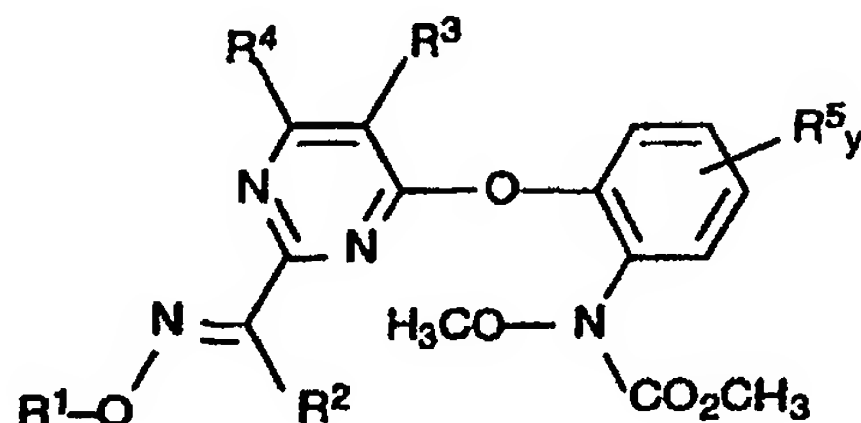
45

Tabelle 10

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.10, in denen R^2 für Me-

thyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5



IA.10

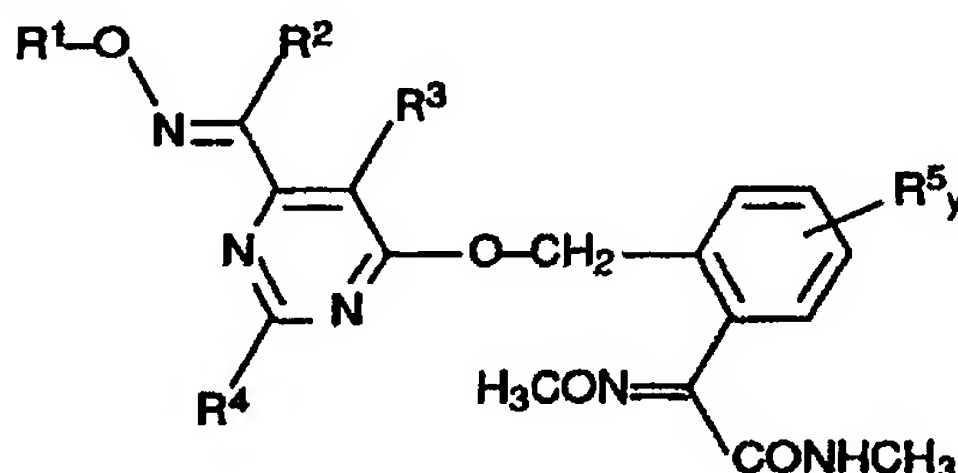
10

Tabelle 11

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.1, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der

15

Tabelle A entspricht



IB.1

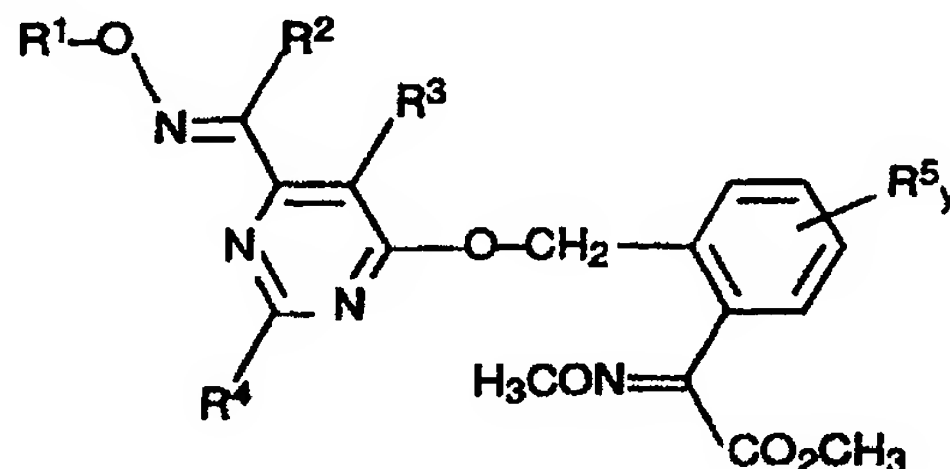
20

Tabelle 12

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.2, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der

25

Tabelle A entspricht



IB.2

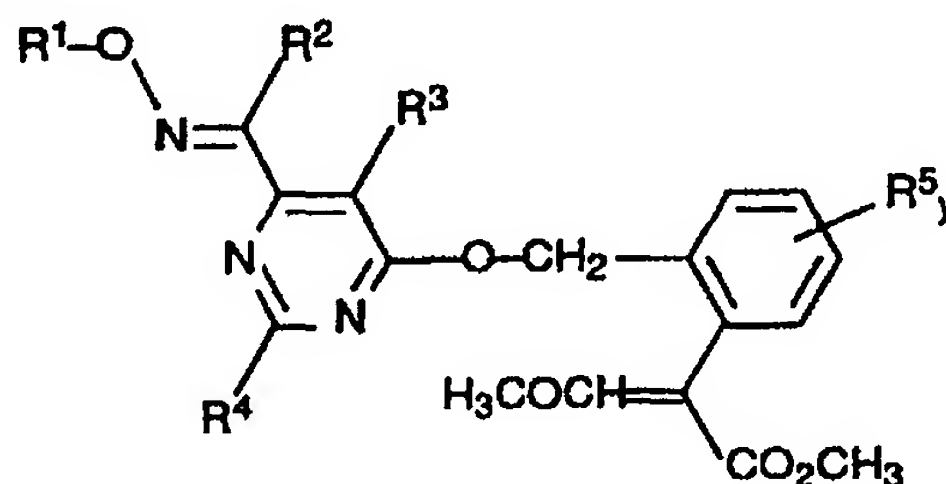
30

35 Tabelle 13

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.3, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Wasserstoff, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der

40

Tabelle A entspricht



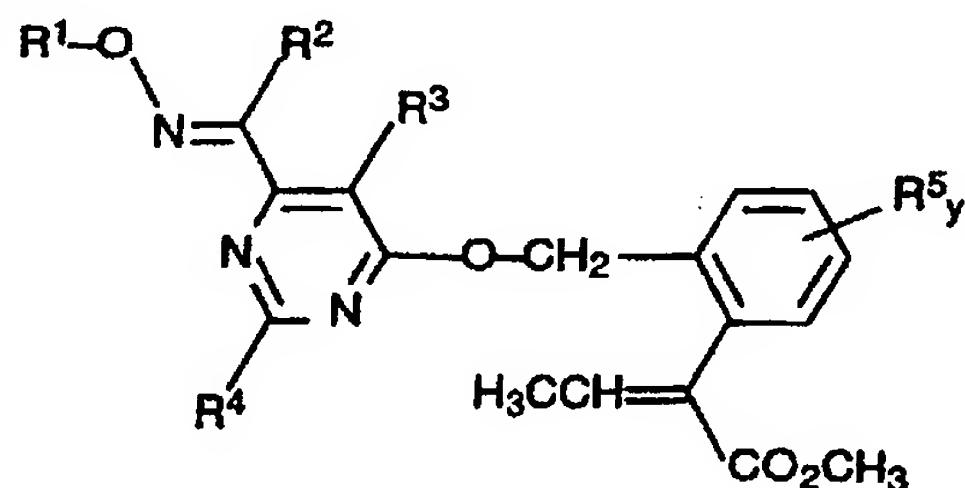
IB.3

45

Tabelle 14

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.4, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5



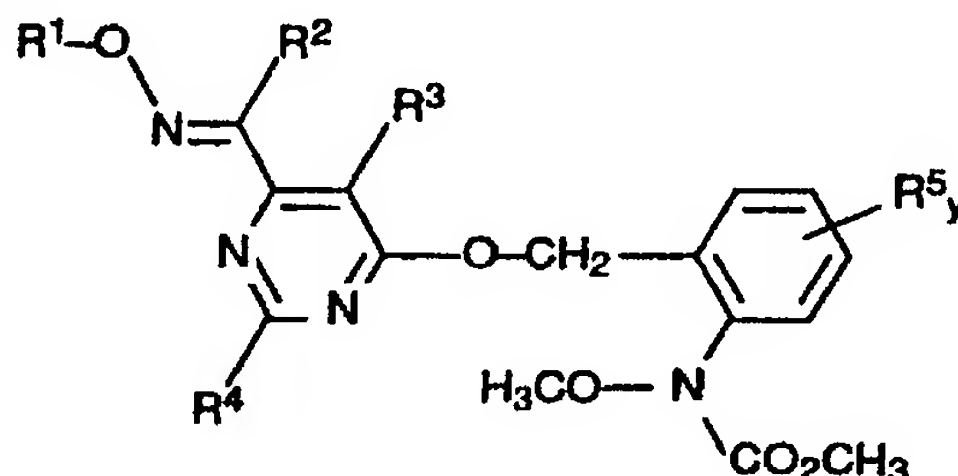
IB.4

10

Tabelle 15

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.5, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15



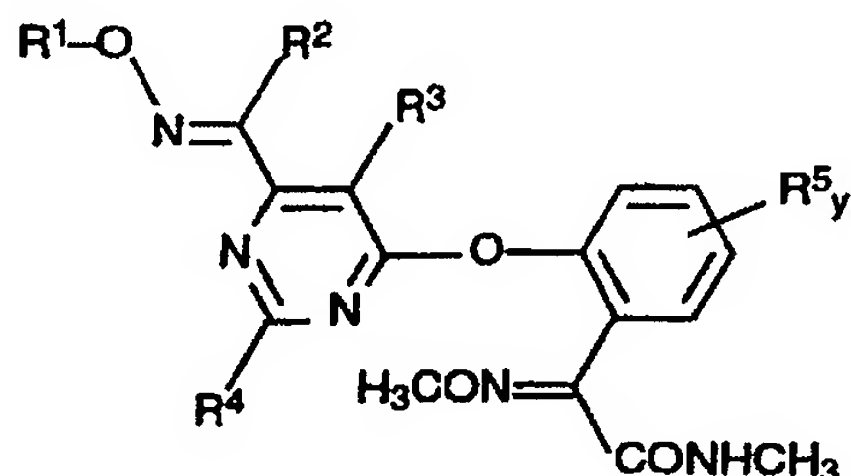
IB.5

20

Tabelle 16

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.6, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25



IB.6

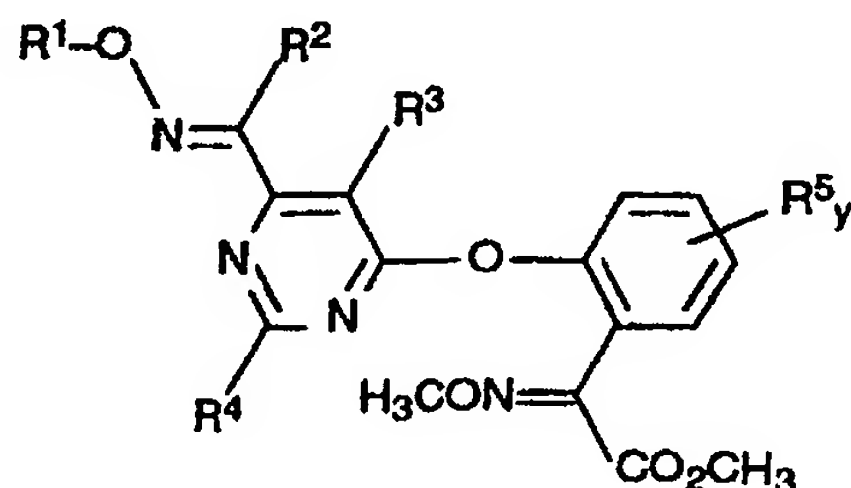
30

35

Tabelle 17

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.7, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

40



IB.7

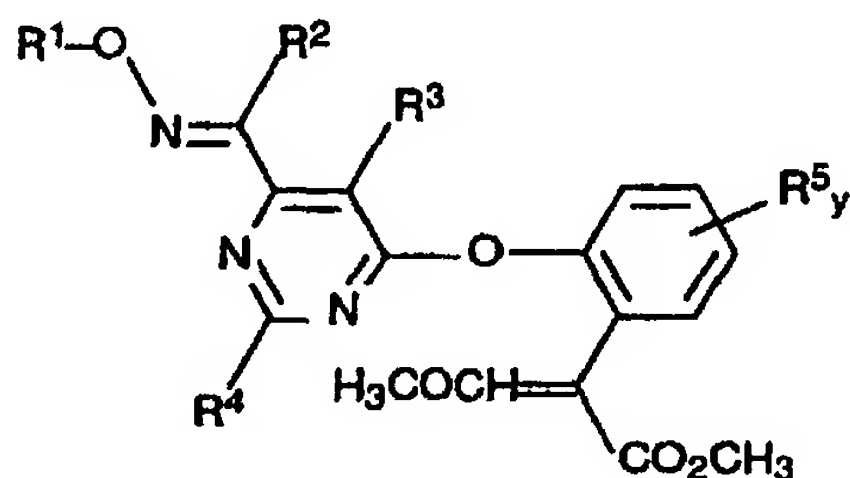
45

Tabelle 18

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.8, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5

10



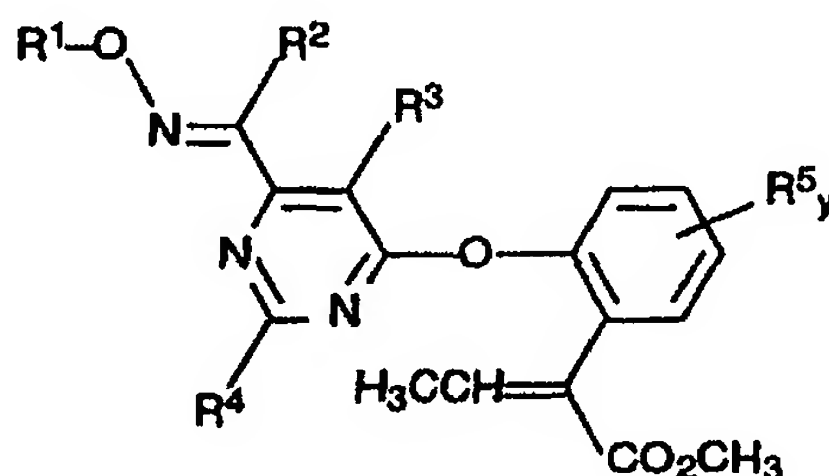
IB.8

Tabelle 19

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.9, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15

20



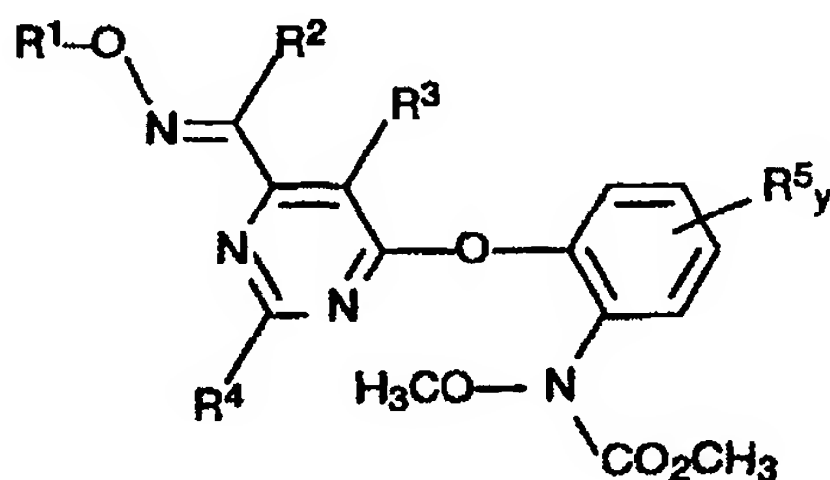
IB.9

Tabelle 20

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.10, in denen R² für Methyl, R³ für Wasserstoff, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

30



IB.10

35

Tabelle 21

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.1, in denen R² für Methyl, R³ für Methyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 22

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.2, in denen R² für Methyl, R³ für Methyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 23

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.3, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 24

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.4, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 25

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.5, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 26

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.6, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 27

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.7, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 28

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.8, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 29

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.9, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

35

40 Tabelle 30

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.10, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Methyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 31

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.1, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff

steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 32

- 5 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.2, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 33

- 10 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.3, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 34

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.4, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 35

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.5, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 36

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.6, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 37

- 35 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.7, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 38

- 40 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.8, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 39

- 45 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.9, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Chlor, R^4 für Wasserstoff und R^5 für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 40

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.10, in denen R² für Methyl, R³ für Chlor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 41

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.1, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 42

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.2, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 43

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.3, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 44

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.4, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 45

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.5, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 46

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.6, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

35

40 Tabelle 47

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.7, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

45

Tabelle 48

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.8, in denen R² für Methyl, R³ für Fluor, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff

steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 49

- 5 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.9, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Fluor, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 50

- 10 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.10, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Fluor, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 51

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.1, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Brom, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 52

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.2, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Brom, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 53

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.3, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Brom, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 54

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.4, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Brom, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

- 35 belle A entspricht

Tabelle 55

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.5, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Brom, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

40

belle A entspricht

Tabelle 56

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.6, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Brom, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

45

belle A entspricht

Tabelle 57

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.7, in denen R² für Methyl, R³ für Brom, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 58

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.8, in denen R² für Methyl, R³ für Brom, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

10 belle A entspricht

Tabelle 59

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.9, in denen R² für Methyl, R³ für Brom, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

15

belle A entspricht

Tabelle 60

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.10, in denen R² für Methyl, R³ für Brom, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Ta-

20

belle A entspricht

Tabelle 61

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.1, in denen R² für Methyl, R³ für Trifluormethyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 62

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.2, in denen R² für Methyl, R³ für Trifluormethyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 63

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.3, in denen R² für Methyl, R³ für Trifluormethyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 64

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.4, in denen R² für Methyl, R³ für Trifluormethyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Wasserstoff steht und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 65

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.5, in denen R² für Methyl, R³ für Trifluormethyl, R⁴ für Wasserstoff und R⁵_y für Was-

45

serstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 66

- 5 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.6, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Trifluormethyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

Tabelle 67

- 10 Verbindungen der allgemeinen Formel IA.7, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Trifluormethyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 68

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.8, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Trifluormethyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 69

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.9, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Trifluormethyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 70

Verbindungen der allgemeinen Formel IA.10, in denen R^2 für Methyl, R^3 für Trifluormethyl, R^4 für Wasserstoff und R^5_y für Wasserstoff steht und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Gruppe der Tabelle A entspricht

30

Tabelle A

Nr.	R^1
35 A.1	H
A.2	CH ₃
A.3	C ₂ H ₅
A.4	n-C ₃ H ₇
40 A.5	i-C ₃ H ₇
A.6	Cyclopropyl
A.7	n-C ₄ H ₉
A.8	s-C ₄ H ₉
45 A.9	i-C ₄ H ₉
A.10	t-C ₄ H ₉
A.11	n-C ₅ H ₁₁

Nr.	R ¹
A.12	i-C ₅ H ₁₁
A.13	neo-C ₅ H ₁₁
5 A.14	Cyclopentyl
A.15	n-C ₆ H ₁₃
A.16	Cyclohexyl
A.17	n-C ₈ H ₁₇
10 A.18	CH ₂ CH ₂ Cl
A.19	(CH ₂) ₄ Cl
A.20	CH ₂ CN
A.21	CH ₂ CH ₂ CN
A.22	(CH ₂) ₃ CN
15 A.23	(CH ₂) ₄ CN
A.24	(CH ₂) ₆ CN
A.25	Cyclohexylmethyl
A.26	2-Cyclohexyleth-1-yl
20 A.27	Cyclopropylmethyl
A.28	2-Cyclopropyleth-1-yl
A.29	2-Methoxyeth-1-yl
A.30	2-Ethoxyeth-1-yl
25 A.31	2-Isopropoxyeth-1-yl
A.32	3-Methoxyprop-1-yl
A.33	3-Ethoxyprop-1-yl
A.34	3-Isopropoxyprop-1-yl
A.35	4-Methoxybut-1-yl
30 A.36	4-Isopropoxybut-1-yl
A.37	Propen-3-yl
A.38	But-2-en-1-yl
A.39	3-Methylbut-2-en-1-yl
35 A.40	2-Vinyloxyeth-1-yl
A.41	Allyloxyeth-1-yl
A.42	2-Trifluormethoxyeth-1-yl
A.43	3-Trifluormethoxyprop-1-yl
40 A.44	4-Difluormethoxybut-1-yl
A.45	Hydroxycarbonylmethyl
A.46	Methoxycarbonylmethyl
A.47	Aminocarbonylmethyl
45 A.48	N-Methylaminocarbonylmethyl
A.49	N,N-Dimethylaminocarbonyl-methyl
A.50	2-Hydroxycarbonyleth-1-yl

Nr.	R ¹
A. 51	2-Methoxycarbonyleth-1-yl
A. 52	2-Aminocarbonyleth-1-yl
5	A. 53 2-N-Methylaminocarbonyleth-1-yl
	A. 54 2-Dimethylaminocarbonyleth-1-yl
	A. 55 2-Aminoeth-1-yl
	A. 56 2-Aminoprop-1-yl
	A. 57 4-Aminobut-1-yl
10	A. 58 3-Dimethylaminoprop-1-yl
	A. 59 4-Aminothiocabonylbut-1-yl
	A. 60 2-Oxopropyl
	A. 61 Cyclohexyl
	A. 62 Cyclopropyl
15	A. 63 Cyclopentyl
	A. 64 2-Methoxyiminoprop-1-yl
	A. 65 2-Methoxyiminoeth-1-yl
	A. 66 6-Aminocarbonylhex-1-yl
	A. 67 3-Aminothiocabonylprop-1-yl
20	A. 68 2-Aminothiocabonyleth-1-yl
	A. 69 Aminothiocabonylmethyl
	A. 70 4-(N,N-Dimethylamino)but-1-yl
	A. 71 2-(Methylthio)eth-1-yl
	A. 72 2-(Methylsulfonyl)eth-1-yl
25	A. 73 4-(Methylthio)prop-1-yl
	A. 74 4-(Methylsulfonyl)prop-1-yl
	A. 75 Benzyl
	A. 76 2-F-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A. 77 3-F-C ₆ H ₄ -CH ₂
30	A. 78 4-F-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A. 79 2,3-F ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A. 80 2,4-F ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A. 81 2,5-F ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A. 82 2,6-F ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
35	A. 83 3,4-F ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A. 84 3,5-F ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A. 85 2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A. 86 3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A. 87 4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂
40	A. 88 2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A. 89 2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂

Nr.	R ¹
A. 90	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 91	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
5 A. 92	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 93	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 94	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
A. 95	2,3,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
10 A. 96	2,3,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
A. 97	2,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
A. 98	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
A. 99	3,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
A. 100	2-Br-C ₆ H ₄ -CH ₂
15 A. 101	3-Br-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 102	4-Br-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 103	2,3-Br ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 104	2,4-Br ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
20 A. 105	2,5-Br ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 106	2,6-Br ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 107	3,4-Br ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 108	3,5-Br ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
25 A. 109	2-F, 3-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 110	2-F, 4-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 111	2-F, 5-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 112	2-F, 3-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 113	2-F, 4-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
30 A. 114	2-F, 5-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 115	2-Cl, 3-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 116	2-Cl, 4-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 117	2-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
35 A. 118	3-F, 4-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 119	3-F, 5-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 120	3-F, 6-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 121	3-F, 4-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
40 A. 122	3-F, 5-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 123	3-F, 6-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 124	3-Cl, 4-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 125	3-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
45 A. 126	3-Cl, 6-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 127	4-F, 5-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 128	4-F, 6-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂

Nr.	R ¹
5	A.129 4-F, 5-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.130 4-F, 6-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.131 4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.132 5-F, 6-Cl-C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.133 5-F, 6-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
10	A.134 5-Cl, 6-Br-C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.135 3-Br, 4-Cl, 5-Br-C ₆ H ₂ -CH ₂
	A.136 2-CN-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.137 3-CN-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.138 4-CN-C ₆ H ₄ -CH ₂
15	A.139 2-NO ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.140 3-NO ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.141 4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.142 2-CH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.143 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
20	A.144 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.145 2,3-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.146 2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.147 2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.148 2,6-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
25	A.149 3,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.150 3,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.151 2-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.152 3-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.153 4-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
30	A.154 2-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.155 3-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.156 4-i-C ₃ H ₇ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.157 2-Cyclohexyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.158 3-Cyclohexyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
35	A.159 4-Cyclohexyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.160 2-Vinyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.161 3-Vinyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.162 4-Vinyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.163 2-Allyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
40	A.164 3-Allyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.165 4-Allyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.166 2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.167 3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂

Nr.	R ¹
A. 168	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 169	3-CH ₃ , 5-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₃ -CH ₂
5 A. 170	2-OH-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 171	3-OH-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 172	4-OH-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 173	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
10 A. 174	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 175	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 176	2,3-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 177	2,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 178	2,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
15 A. 179	3,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 180	3,5-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃ -CH ₂
A. 181	3,4,5-(OCH ₃) ₃ -C ₆ H ₂ -CH ₂
A. 182	2-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
20 A. 183	3-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 184	4-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 185	2-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 186	3-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄ -CH ₂
25 A. 187	4-O-(n-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 188	2-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 189	3-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 190	4-O-(i-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₄ -CH ₂
30 A. 191	4-O-(n-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 192	3-O-(t-C ₄ H ₉)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 193	4-O-(n-C ₆ H ₁₃)-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 194	2-O-Allyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 195	3-O-Allyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
35 A. 196	4-O-Allyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 197	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 198	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 199	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
40 A. 200	2-Acetyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 201	3-Acetyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 202	4-Acetyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 203	2-Methoxycarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
45 A. 204	3-Methoxycarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 205	4-Methoxycarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
A. 206	2-Aminocarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂

Nr.	R ¹
5	A.207 3-Aminocarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.208 4-Aminocarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.209 2-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.210 3-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.211 4-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
10	A.212 2-(N-Methylaminocarbonyl)-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.213 3-(N-Methylaminocarbonyl)-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.214 4-(N-Methylaminocarbonyl)-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.215 2-H ₂ N-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.216 3-H ₂ N-C ₆ H ₄ -CH ₂
15	A.217 4-H ₂ N-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.218 2-Aminothiocabonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.219 3-Aminothiocabonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.220 4-Aminothiocabonyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.221 2-Methoxyiminomethyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
20	A.222 3-Methoxyiminomethyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.223 4-Methoxyiminomethyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.224 2-Formyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.225 3-Formyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.226 4-Formyl-C ₆ H ₄ -CH ₂
25	A.227 2-(1'-Methoxyiminoeth-1'-yl)-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.228 3-(1'-Methoxyiminoeth-1'-yl)-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.229 4-(1'-Methoxyiminoeth-1'-yl)-C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.230 2-SCH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.231 3-SCH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
30	A.232 4-SCH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.233 2-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.234 3-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.235 4-SO ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.236 2-OCF ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
35	A.237 3-OCF ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.238 4-OCF ₃ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.239 2-OCHF ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.240 3-OCHF ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A.241 4-OCHF ₂ -C ₆ H ₄ -CH ₂
40	A.242 3-CF ₃ , 4-OCF ₃ -C ₆ H ₃ -CH ₂
	A.243 1-Naphthyl-CH ₂
	A.244 2-Naphthyl-CH ₂
	A.245 2-Phenoxyeth-1-yl

Nr.	R ¹
5	A. 246 2-(2'-Chlorphenoxy)eth-1-yl
	A. 247 2-(3'-Chlorphenoxy)eth-1-yl
	A. 248 2-(4'-Chlorphenoxy)eth-1-yl
	A. 249 2-(3',5'-Dichlorphenoxy)eth-1-yl
	A. 250 2-(2'-Cyanophenoxy)eth-1-yl
10	A. 251 2-(3'-Cyanophenoxy)eth-1-yl
	A. 252 2-(4'-Cyanophenoxy)eth-1-yl
	A. 253 2-(2'-Methylphenoxy)eth-1-yl
	A. 254 2-(3'-Methylphenoxy)eth-1-yl
	A. 255 2-(4'-Methylphenoxy)eth-1-yl
15	A. 256 2-(3'-t-Butylphenoxy)eth-1-yl
	A. 257 2-(4'-t-Butylphenoxy)eth-1-yl
	A. 258 2-(2'-Nitrophenoxy)eth-1-yl
	A. 259 2-(3'-Nitrophenoxy)eth-1-yl
	A. 260 2-(4'-Nitrophenoxy)eth-1-yl
20	A. 261 2-(2'-Methoxyphenoxy)eth-1-yl
	A. 262 2-(3'-Methoxyphenoxy)eth-1-yl
	A. 263 2-(4'-Methoxyphenoxy)eth-1-yl
	A. 264 2-(2'-Trifluormethylphenoxy)eth-1-yl
	A. 265 2-(3'-Trifluormethylphenoxy)eth-1-yl
25	A. 266 2-(4'-Trifluormethylphenoxy)eth-1-yl
	A. 267 2-(2'-Acetylphenoxy)eth-1-yl
	A. 268 2-(3'-Acetylphenoxy)eth-1-yl
	A. 269 2-(4'-Acetylphenoxy)eth-1-yl
	A. 270 2-(2'-Methoxycarbonyl)eth-1-yl
30	A. 271 2-(3'-Methoxycarbonyl)eth-1-yl
	A. 272 2-(4'-Methoxycarbonyl)eth-1-yl
	A. 273 2-(2'-Dimethylaminocarbonyl)eth-1-yl
	A. 274 2-(3'-Dimethylaminocarbonyl)eth-1-yl
	A. 275 2-(4'-Dimethylaminocarbonyl)eth-1-yl
35	A. 276 2-(2'-Aminothiocabonyl)eth-1-yl
	A. 277 2-(3'-Aminothiocabonyl)eth-1-yl
	A. 278 2-(4'-Aminothiocabonyl)eth-1-yl
	A. 279 2-(2'-Methylsulfonyl)eth-1-yl
	A. 280 2-(3'-Methylsulfonyl)eth-1-yl
40	A. 281 2-(4'-Methylsulfonyl)eth-1-yl
	A. 282 3-Phenoxyprop-1-yl
	A. 283 3-(2'-Chlorphenoxy)prop-1-yl
	A. 284 3-(3'-Chlorphenoxy)prop-1-yl
	A. 284 3-(3'-Chlorphenoxy)prop-1-yl

Nr.	R ¹
A.285	3-(4'-Chlorphenoxy)prop-1-yl
A.286	3-(3',5',Dichlorphenoxy)prop-1-yl
5 A.287	3-(2'-Cyanophenoxy)prop-1-yl
A.288	3-(3'-Cyanophenoxy)prop-1-yl
A.289	3-(4'-Cyanophenoxy)prop-1-yl
A.290	3-(2'-Methylphenoxy)prop-1-yl
A.291	3-(3'-Methylphenoxy)prop-1-yl
10 A.292	3-(4'-Methylphenoxy)prop-1-yl
A.293	3-(2'-Methoxyphenoxy)prop-1-yl
A.294	3-(3'-Methoxyphenoxy)prop-1-yl
A.295	3-(4'-Methoxyphenoxy)prop-1-yl
15 A.296	3-(2'-Trifluormethylphenoxy)prop-1-yl
A.297	3-(3'-Trifluormethylphenoxy)prop-1-yl
A.298	3-(4'-Trifluormethylphenoxy)prop-1-yl
A.299	4-Phenoxybut-1-yl
20 A.300	2-Phenyleth-1-yl
A.301	2-(2'-Chlorphenyl)eth-1-yl
A.302	2-(3'-Chlorphenyl)eth-1-yl
A.303	2-(4'-Chlorphenyl)eth-1-yl
A.304	2-(3',5'-Dichlorphenyl)eth-1-yl
25 A.305	2-(2'-Cyanophenyl)eth-1-yl
A.306	2-(3'-Cyanophenyl)eth-1-yl
A.307	2-(4'-Cyanophenyl)eth-1-yl
A.308	2-(2'-Methylphenyl)eth-1-yl
30 A.309	2-(3'-Methylphenyl)eth-1-yl
A.310	2-(4'-Methylphenyl)eth-1-yl
A.311	2-(2'-Methoxyphenyl)eth-1-yl
A.312	2-(3'-Methoxyphenyl)eth-1-yl
35 A.313	2-(4'-Methoxyphenyl)eth-1-yl
A.314	2-(2'-Trifluormethylphenyl)eth-1-yl
A.315	2-(3'-Trifluormethylphenyl)eth-1-yl
A.316	2-(4'-Trifluormethylphenyl)eth-1-yl
40 A.317	3-Phenylprop-1-yl
A.318	3-(2'-Chlorphenyl)prop-1-yl
A.319	3-(3'-Chlorphenyl)prop-1-yl
A.320	3-(4'-Chlorphenyl)prop-1-yl
A.321	3-(2'-Cyanophenyl)prop-1-yl
45 A.322	3-(3'-Cyanophenyl)prop-1-yl
A.323	3-(4'-Cyanophenyl)prop-1-yl

Nr.	R ¹
A.324	3-(2'-Trifluormethylphenyl)prop-1-yl
A.325	4-Phenylbut-1-yl
5 A.326	4-(4'-Chlorphenyl)but-1-yl
A.327	6-(4'-Chlorphenyl)hex-1-yl
A.328	2-Pyridylmethyl
A.329	3-Pyridylmethyl
A.330	4-Pyridylmethyl
10 A.331	4-Chlorpyridin-2-ylmethyl
A.332	5-Chlorpyridin-2-ylmethyl
A.333	6-Chlorpyridin-2-ylmethyl
A.334	5-Chlorpyridin-3-ylmethyl
15 A.335	6-Chlorpyridin-3-ylmethyl
A.336	2-Chlorpyridin-4-ylmethyl
A.337	2-Pyrimidinylmethyl
A.338	4-Chlorpyrimidin-2-ylmethyl
20 A.339	5-Chlorpyrimidin-2-ylmethyl
A.340	2-Chlorpyrimidin-4-ylmethyl
A.341	6-Chlorpyrimidin-4-ylmethyl
A.342	2-Chlorpyrimidin-5-ylmethyl
A.343	4-Pyridazinylmethyl
25 A.344	2-Pyrazinylmethyl
A.345	5-Chlorpyrazin-2-ylmethyl
A.346	6-Chlorpyrazin-2-ylmethyl
A.347	3-Pyridazinylmethyl
30 A.348	6-Chlorpyridazin-3-ylmethyl
A.349	1,3,5-Triazinylmethyl
A.350	2-Furylmethyl
A.351	3-Furylmethyl
35 A.352	4-Bromfur-2-ylmethyl
A.353	5-Chlorfur-2-ylmethyl
A.354	2-Thienylmethyl
A.355	3-Thienylmethyl
40 A.356	5-Methylthien-3-ylmethyl
A.357	5-Chlorthien-2-ylmethyl
A.358	2-Chlorthien-4-ylmethyl
A.359	2-Pyrrolylmethyl
A.360	3-Pyrrolylmethyl
45 A.361	2-Oxazolylmethyl
A.362	4-Methyloxazol-2-ylmethyl

Nr.	R ¹
5	A.363 5-Methyloxazol-2-ylmethyl
	A.364 4-Chloroxazol-2-ylmethyl
	A.365 5-Chloroxazol-2-ylmethyl
	A.366 4-Oxazolylmethyl
	A.367 2-Methyloxazol-4-ylmethyl
10	A.368 5-Methyloxazol-4-ylmethyl
	A.369 2-Chloroxazol-4-ylmethyl
	A.370 5-Chloroxazol-4-ylmethyl
	A.371 5-Oxazolylmethyl
	A.372 2-Methyloxazol-5-ylmethyl
15	A.373 4-Methyloxazol-5-ylmethyl
	A.374 2-Chloroxazol-5-ylmethyl
	A.375 4-Chloroxazol-5-ylmethyl
	A.376 2-Thiazolylmethyl
	A.377 4-Methylthiazol-2-ylmethyl
20	A.378 5-Methylthiazol-2-ylmethyl
	A.379 4-Chlorthiazol-2-ylmethyl
	A.380 5-Chlorthiazol-2-ylmethyl
	A.381 4-Thiazolylmethyl
	A.382 2-Methylthiazol-4-ylmethyl
25	A.383 5-Methylthiazol-4-ylmethyl
	A.384 2-Chlorthiazol-4-ylmethyl
	A.385 5-Chlorthiazol-4-ylmethyl
	A.386 5-Thiazolylmethyl
	A.387 2-Methylthiazol-5-ylmethyl
30	A.388 4-Methylthiazol-5-ylmethyl
	A.389 2-Chlorthiazol-5-ylmethyl
	A.390 4-Chlorthiazol-5-ylmethyl
	A.391 3-Isloxazolylmethyl
	A.392 4-Methylisoxazol-3-ylmethyl
35	A.393 5-Methylisoxazol-3-ylmethyl
	A.394 4-Chlorisoxazol-3-ylmethyl
	A.395 5-Chlorisoxazol-3-ylmethyl
	A.396 4-Isloxazolylmethyl
	A.397 3-Methylisoxazol-4-ylmethyl
40	A.398 5-Methylisoxazol-4-ylmethyl
	A.399 3-Chlorisoxazol-4-ylmethyl
	A.400 5-Chlorisoxazol-4-ylmethyl
	A.401 5-Isloxazolylmethyl

Nr.	R ¹
5	A.402 3-Methylisoxazol-5-ylmethyl
	A.403 4-Methylisoxazol-5-ylmethyl
	A.404 3-Chlorisoxazol-5-ylmethyl
	A.405 4-Chlorisoxazol-5-ylmethyl
	A.406 3-Isothiazolylmethyl
10	A.407 4-Methylisothiazol-3-ylmethyl
	A.408 5-Methylisothiazol-3-ylmethyl
	A.409 4-Chlorisothiazol-3-ylmethyl
	A.410 5-Chlorisothiazol-3-ylmethyl
	A.411 4-Isothiazolylmethyl
15	A.412 3-Methylisothiazol-4-ylmethyl
	A.413 5-Methylisothiazol-4-ylmethyl
	A.414 3-Chlorisothiazol-4-ylmethyl
	A.415 5-Chlorisothiazol-4-ylmethyl
	A.416 5-Isothiazolylmethyl
20	A.417 3-Methylisothiazol-5-ylmethyl
	A.418 4-Methylisothiazol-5-ylmethyl
	A.419 3-Chlorisothiazol-5-ylmethyl
	A.420 4-Chlorisothiazol-5-ylmethyl
	A.421 4-Imidazolylmethyl
25	A.422 1-Phenylpyrazol-3-ylmethyl
	A.423 1-Methylimidazol-4-ylmethyl
	A.424 1-Phenyl-1,2,4-triazol-3-ylmethyl
	A.425 1,2,4-Oxadiazol-3-ylmethyl
	A.426 5-Chlor-1,2,4-oxadiazol-3-ylmethyl
30	A.427 5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-ylmethyl
	A.428 5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-ylmethyl
	A.429 1,3,4-Oxadiazol-2-ylmethyl
	A.430 5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-ylmethyl
	A.431 5-Methyl-1,3,4-oxadiazol-2-ylmethyl
35	A.432 5-Methoxy-1,3,4-oxadiazol-2-ylmethyl
	A.433 1,2,4-Thiadiazol-3-ylmethyl
	A.434 5-Chlor-1,2,4-thiadiazol-3-ylmethyl
	A.435 5-Methyl-1,2,4-thiadiazol-3-ylmethyl
	A.436 1,3,4-Thiadiazol-2-ylmethyl
40	A.437 5-Chlor-1,3,4-thiadiazol-2-ylmethyl
	A.438 5-Methyl-1,3,4-thiadiazol-2-ylmethyl
	A.439 5-Cyano-1,3,4-thiadiazol-2-ylmethyl
	A.440 2-(2'-Pyridinyloxy)eth-1-yl

Nr.	R ¹
5	A.441 2-(3'-Pyridinyloxy)eth-1-yl
	A.442 2-(4'-Pyridinyloxy)eth-1-yl
	A.443 2-(2'-Pyrimidinyloxy)eth-1-yl
	A.444 2-(4'-Pyrimidinyloxy)eth-1-yl
	A.445 2-(5'-Pyrimidinyloxy)eth-1-yl
10	A.446 2-(2'-Pyrazinyloxy)eth-1-yl
	A.447 2-(2'-Pyridazinyloxy)eth-1-yl
	A.448 2-(3'-Pyridazinyloxy)eth-1-yl
	A.449 2-(1',3',5'-Triazinyloxy)eth-1-yl
	A.450 2-(5'-Methylisoxazol-3'-yloxy)eth-1-yl
15	A.451 2-(5'-Chlorisoxazol-3'-yloxy)eth-1-yl
	A.452 2-(2'-Methoxythiazol-4'-yloxy)eth-1-yl
	A.453 2-(4'-Chloroxazol-2'-yloxy)eth-1-yl
	A.454 2-(1'-Phenyl-1'H-1',2',4'-triazol-3'-yloxy)eth-1-yl
	A.455 2-(1'-Phenylpyrazol-3'-yloxy)eth-1-yl
20	A.456 C ₆ H ₅
	A.457 2-Cl-C ₆ H ₄
	A.458 3-Cl-C ₆ H ₄
	A.459 4-Cl-C ₆ H ₄
	A.460 2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃
25	A.461 2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
	A.462 2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
	A.463 3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
	A.464 3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
	A.465 4-CN-C ₆ H ₄
30	A.466 2-NO ₂ -C ₆ H ₄
	A.467 3-NO ₂ -C ₆ H ₄
	A.468 4-NO ₂ -C ₆ H ₄
	A.469 2,4-(NO ₂) ₂ -C ₆ H ₃
	A.470 2-CH ₃ -C ₆ H ₄
35	A.471 3-CH ₃ -C ₆ H ₄
	A.472 4-CH ₃ -C ₆ H ₄
	A.473 2,3-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
	A.474 2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
	A.475 2,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
40	A.476 2,6-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
	A.477 2-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
	A.478 3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
	A.479 4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄

Nr.	R ¹
A. 480	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄
A. 481	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄
5 A. 482	3-Acetyl-C ₆ H ₄
A. 483	4-Acetyl-C ₆ H ₄
A. 484	3-Methoxycarbonyl-C ₆ H ₄
A. 485	4-Methoxycarbonyl-C ₆ H ₄
10 A. 486	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
A. 487	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
A. 488	2-Naphthyl
A. 489	6-Chlorpyridazin-3-yl
A. 490	5-Chlorpyrazin-2-yl
15 A. 491	Chinolin-2-yl
A. 492	2,5-Dimethylpyrazin-3-yl
A. 493	Pyrazin-2-yl
A. 494	3-Chlorpyrid-2-yl
20 A. 495	6-Chlorpyrid-2-yl
A. 496	4-Trifluormethyl, 6-Chlorpyrid-2-yl
A. 497	4-Trifluormethylpyrid-2-yl
A. 498	6-Trifluormethylpyrid-2-yl
25 A. 499	6-Methoxypyrid-2-yl
A. 500	5-Chlorpyrid-2-yl
A. 501	Pyrid-2-yl
A. 502	Benzothiazol-2-yl
A. 503	7-Chlorchinolin-4-yl
30 A. 504	3-Nitropyrid-2-yl
A. 505	Pyrrol-3-yl
A. 506	Pyrrol-2-yl
A. 507	2,6-Dioctylpyrid-4-yl
35 A. 508	5-Nitropyrid-2-yl
A. 509	Pyrid-4-yl
A. 510	Pyrid-3-yl
A. 511	Pyrimidin-2-yl
40 A. 512	Pyrimidin-4-yl
A. 513	Chinazolin-4-yl
A. 514	6-Chlorpyrimidin-4-yl
A. 515	6-Methoxypyrimidin-4-yl
45 A. 516	2,5,6-Trichlorpyrimidin-4-yl
A. 517	2,6-Dimethylpyrimidin-4-yl
A. 518	2-Methyl, 6-Chlorpyrimidin-4-yl

Nr.	R ¹
5	A.519 2-Methyl, 6-Ethoxypyrimidin-4-yl
	A.520 4,5,6-Trichlorpyrimidin-2-yl
	A.521 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	A.522 4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl
	A.523 4,6-Dichlorpyrimidin-2-yl
10	A.524 4-Methyl, 6-methoxypyrimidin-2-yl
	A.525 4-Chlor, 6-methoxypyrimidin-2-yl
	A.526 6-Chlorchinoxalin-2-yl
	A.527 3,6-Dichlor-1,2,4-triazin-5-yl
	A.528 4-Methoxy-1,3,5-triazin-2-yl
15	A.529 4-Ethoxy-1,3,5-triazin-2-yl
	A.530 4,6-Dichlor-1,3,5-triazin-2-yl
	A.531 4-Ethoxy, 6-Chlor-1,3,5-triazin-2-yl
	A.532 Isoxazol-3-yl
	A.533 Thien-2-yl
20	A.534 Fur-2-yl
	A.535 Thiatriazol-5-yl
	A.536 (E)-1-Chlorpropen-3-yl
	A.537 (E)-4-(4'-Chlorphenyl)but-2-en-1-yl
	A.538 Propin-3-yl
25	A.539 Methylcarbonyl
	A.540 Ethylcarbonyl
	A.541 n-Propylcarbonyl
	A.542 i-Propylcarbonyl
	A.543 n-Butylcarbonyl
30	A.544 s-Butylcarbonyl
	A.545 i-Butylcarbonyl
	A.546 t-Butylcarbonyl
	A.547 n-Pentylcarbonyl
	A.548 i-Pentylcarbonyl
35	A.549 neo-Pentylcarbonyl
	A.550 n-Hexylcarbonyl
	A.551 n-Octylcarbonyl
	A.552 1-Propenylcarbonyl
	A.553 2-Penten-1-yl-carbonyl
40	A.554 2,5-Heptadien-1-yl-carbonyl
	A.555 Benzoyl
	A.556 2-Chlorbenzoyl
	A.557 3-Chlorbenzoyl

Nr.	R ¹
5	A. 558 4-Chlorbenzoyl
	A. 559 2-Cyanobenzoyl
	A. 560 3-Cyanobenzoyl
	A. 561 4-Cyanobenzoyl
	A. 562 4-Methoxybenzoyl
10	A. 563 2-Pyridylcarbonyl
	A. 564 3-Pyridylcarbonyl
	A. 565 4-Pyridylcarbonyl
	A. 566 2-Pyrimidinylcarbonyl
	A. 567 2-Oxazolylcarbonyl
15	A. 568 4-Methylisoxazol-5-ylcarbonyl
	A. 569 Methylsulfonyl
	A. 570 Ethylsulfonyl
	A. 571 n-Propylsulfonyl
	A. 572 i-Propylsulfonyl
20	A. 573 n-Butylsulfonyl
	A. 574 t-Butylsulfonyl
	A. 575 n-Pentylsulfonyl
	A. 576 neo-Pentylsulfonyl
	A. 577 n-Hexylsulfonyl
25	A. 578 n-Octylsulfonyl
	A. 579 Phenylsulfonyl
	A. 580 2-Chlorphenylsulfonyl
	A. 581 3-Chlorphenylsulfonyl
	A. 582 4-Chlorphenylsulfonyl
30	A. 583 2-Cyanophenylsulfonyl
	A. 584 3-Cyanophenylsulfonyl
	A. 585 4-Cyanophenylsulfonyl
	A. 586 2-Pyridylsulfonyl
	A. 587 3-Pyridylsulfonyl
35	A. 588 4-Pyridylsulfonyl
	A. 589 2-Pyrimidinylsulfonyl
	A. 590 4-Oxazolylsulfonyl
	A. 591 5-Chlorthiazol-2-ylsulfonyl
	A. 592 2-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ -CH ₂
40	A. 593 3-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A. 594 4-t-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ -CH ₂
	A. 595 2-(4'-Chlorthiazol-2'-yloxy)eth-1-yl
	A. 596 2-(1'-Methylpyrazol-4'-yloxy)eth-1-yl
45	

Nr.	R ¹
A. 597	4-Br-C ₆ H ₄
A. 598	3,5-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃
5 A. 599	4-C ₂ H ₅ -C ₆ H ₄
A. 600	3-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄
A. 601	4-Dimethylaminocarbonyl-C ₆ H ₄
A. 602	2-Hydroxyprop-1-yl
A. 603	6-Hydroxy-2-methylpyrimidin-4-ylmethyl
10 A. 604	[6-OH, 2-CH(CH ₃) ₂ -pyrimidin-4-yl]-CH ₂
A. 605	[6-OH, 2-CH(CH ₂) ₂ -pyrimidin-4-yl]-CH ₂
A. 606	5-(2'-Furan)-pent-1-yl
A. 607	5-(2'-N-Methylpyrrol)-pent-1-yl
15 A. 608	[2-(4-Cl-C ₆ H ₄)-oxazol-4-yl]-CH ₂
A. 609	3-CF ₃ -pyridin-2-yl
A. 610	5-CF ₃ -pyridin-2-yl
A. 611	6-(2'-Thienyl)hex-1-yl

20

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide.

Die Verbindungen I zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

25 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten: Erysiphe graminis (echter Mehltau) in Getreide, Erysiphe cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen, 40 Podosphaera leucotricha an Äpfeln, Uncinula necator an Reben, Puccinia-Arten an Getreide, Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen, Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, Venturia inaequalis (Schorf) an Äpfeln, Helminthosporium-Arten an Getreide, Septoria nodorum an Weizen, Botrytis cinerea (Grauschimmel) 45 an Erdbeeren, Gemüse und Zierpflanzen, Reben, Cercospora arachidicola an Erdnüssen, Pseudocercospora herpotrichoides an Weizen, Gerste, Pyricularia oryzae an Reis, Phytophthora infestans

an Kartoffeln und Tomaten, Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen, Plasmopara viticola an Reben, Alternaria-Arten an Gemüse und Obst.

- 5 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder
10 die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung erfolgt vor oder nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze.

- 15 Sie können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindungen gewährleisten.
20 sten. Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als
25 Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate)
30 nate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

40

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

45

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

- 5 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

10

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln.

15

Beim Vermischen mit Fungiziden erhält man dabei in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

- Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdi-
25 thiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-ethylendiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thio-
30 carbamoyl)disulfid;

- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-
35 isopropylester;

- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethylphthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phos-
40 phinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydro-
45 phthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,

N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäure-
 diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanme-
 thylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-
 Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon, Pyridin-2-thio-
 5 1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-
 5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxani-
 lido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-
 pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid,
 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-
 10 3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexyl-
 amid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäure-
 amid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-
 Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-
 diylbis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranili-
 15 no)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-
 morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpho-
 lin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpro-
 pyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-
 methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-
 20 dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphe-
 nyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-
 Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff,
 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-bu-
 tanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-
 25 yl)-2-butanol, α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-
 methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin,
 Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbo-
 nyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioure-
 ido)-benzol,
 30 sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-
 (3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexa-
 chlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-ala-
 ninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-
 35 methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-amino-
 butyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alanin-
 methylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-
 1,3-oxazolidin, 3-[3,5-Dichlorphenyl(-5-methyl-5-methoxymethyl)-
 1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcar-
 40 bamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-
 1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-meth-
 oximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-
 triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydry-
 lalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-tri-
 45 fluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-me-
 thylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-tolyl]-acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl-oxy]-phenyl}-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(2,5-dimethyl-5 phenoxy)-o-tolyl]-acetamid.

Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-(4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl)-anilin.

10

Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril.

Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 acrylsäuremorpholid.

Die Verbindungen der Formel I sind außerdem geeignet, Schädlinge aus der Klasse der Insekten, Spinnentiere und Nematoden wirksam zu bekämpfen. Sie können im Pflanzenschutz sowie auf dem Hygiene-, Vorratsschutz- und Veterinärsektor als Schädlingsbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Zu den schädlichen Insekten gehören aus der Ordnung der Schmetterlinge (Lepidoptera) beispielsweise *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*,

Thaumtopoea pityocampa, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni*, *Zelophra canadensis*.

Aus der Ordnung der Käfer (Coleoptera) beispielsweise *Agrilus*
 5 *sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus sol-*
stitialis, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus po-*
morum, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga un-*
data, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Bycti-*
 10 *scus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorr-*
hynchus assimilis, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*,
Conoderus vespertinus, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicor-*
nis, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna va-*
rivestis, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylo-*
bius abietis, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typogra-*
 15 *phus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*,
Limonius californicus, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus com-*
munis, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha*
melolontha, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhyn-*
chus ovatus, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*,
 20 *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*,
Phyllotreta striolata, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus*, *Sito-*
philus granaria.

Aus der Ordnung der Zweiflügler (Diptera) beispielsweise *Aedes*
 25 *aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipen-*
nis, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivo-*
rax, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia an-*
thropophaga, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Das-*
ineura brassicae, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*,
 30 *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis eques-*
tris, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*,
Liriomyza trifolii, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia*
sericata, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domes-*
tica, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya*
 35 *hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarc-*
tata, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*,
Tipula oleracea, *Tipula paludosa*.

Aus der Ordnung der Thripse (Thysanoptera) beispielsweise *Fran-*
 40 *kliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tri-*
tici, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi*, *Thrips*
tabaci.

Aus der Ordnung der Hautflügler (Hymenoptera) beispielsweise *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*.

5

Aus der Ordnung der Wanzen (Heteroptera) beispielsweise *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*.

Aus der Ordnung der Pflanzensauger (Homoptera) beispielsweise *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*,
15 *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Aphis sambuci*, *Brachycaudus cardui*, *Brevicoryne brassicae*, *Cerosipha gossypii*, *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Empoasca fabae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Metopolophium dirhodum*,
20 *Myzodes persicae*, *Myzus cerasi*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Viteus vitifolii*.

25

Aus der Ordnung der Termiten (Isoptera) beispielsweise *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*.

30 Aus der Ordnung der Geradflügler (Orthoptera) beispielsweise *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*,
35 *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*.

Aus der Klasse der Arachnoidea beispielsweise Spinnentiere (Acarina) wie *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia praetiosa*, *Dermacentor silvarum*, *Eotetranychus carpini*, *Eriophyes sheldoni*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*,
45 *Otobius megnini*, *Paratetranychus pilosus*, *Dermanyssus gallinae*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Pso-roptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus ever-*

tsi, *Sarcoptes scabiei*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius*, *Tetranychus urticae*.

- 5 Aus der Klasse der Nematoden beispielsweise Wurzelgallennematoden, z.B. *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, Zysten bildende Nematoden, z.B. *Globodera rostochiensis*, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, Stock- und Blattälchen, z.B. *Belonolaimus longicaudatus*, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Longidorus elongatus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus robustus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi*.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dis-
20 pensionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfin-
25 dungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden.

- 30 Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formu-
35 lierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Die Aufwandmenge an Wirkstoff zur Bekämpfung von Schädlingen beträgt unter Freilandbedingungen 0,1 bis 2,0, vorzugsweise 0,2
40 bis 1,0 kg/ha.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner
45 Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylier-

te Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 5 Wasser, in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsio- 10 nen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder 15 Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensati- 25 onsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyletheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kon- 30 densate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitaugen und Methylcellulose in Betracht.

35 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 40 95Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

45 Beispiele für Formulierungen sind:

- I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 5
- II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 10
- III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- 15
- IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- 20
- 25
- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- 30
- 35
- VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 40
- VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält
- 45

man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit
5 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der
10 Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe
15 hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Am-
20 moniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

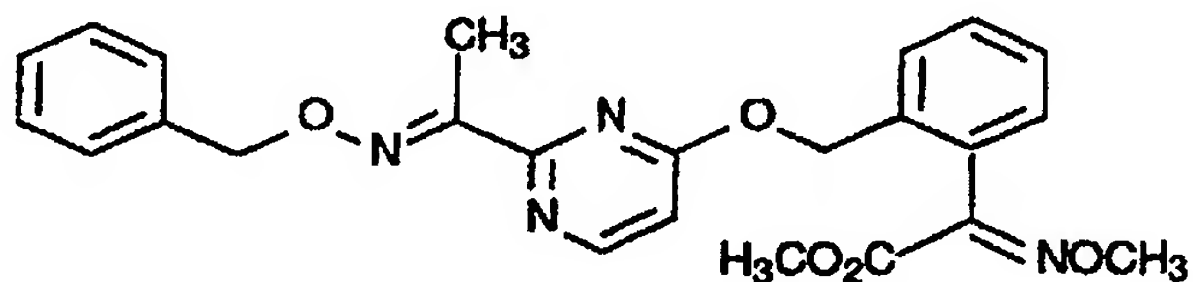
Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide,
25 Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

30 Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangs-
verbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die
35 so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1: E-2-Methoxyimino-2-[(2-[2-(benzyloximinoeth-1'-yl)-
pyrimidin-4-yl)]oxy-methyl)phenyl]essigsäuremethylester (Verbindung Nr. I.38)

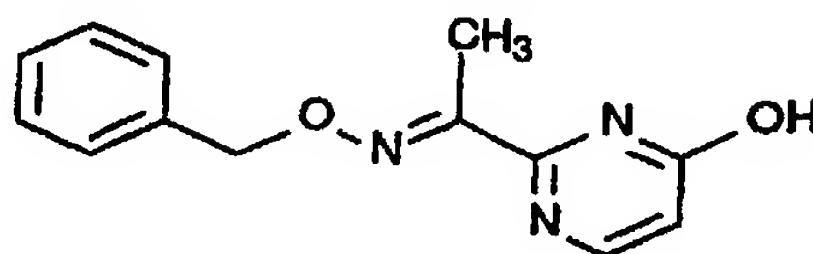
40



45

Stufe 1: 4-Hydroxy-2-(benzyloximinoeth-1'-yl)-pyrimidin

5



2,6 g 4-Hydroxy-2-acetylpyrimidinhydrochlorid, 3g 20%-ige wäßrige Natronlauge und 2,16g Benzyloxyaminhydrochlorid wurden in 35 ml Methanol vorgelegt und mit 10%-iger wäßriger HCl auf pH 5 gestellt. Es wurde vier Stunden bei 40°C dann 14 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde eingeeengt. Das verbleibende Rohprodukt wurde mit Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen und getrocknet. Es wurde erneut eingeeengt. Das verbleibende Rohprodukt wurde an Kieselgel mit Essigester gereinigt. Man erhielt 2,6 g 4-Hydroxy-2-(benzyloximinoeth-1'-yl)-pyrimidin als hellgelben Feststoff (Fp.: 142 - 143°C).

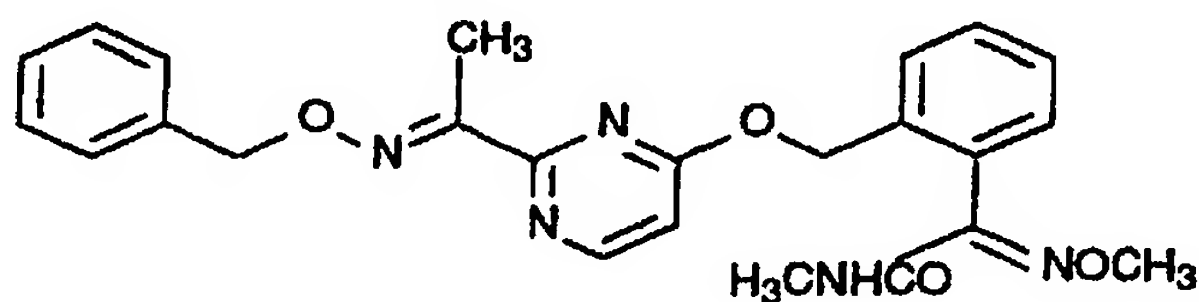
Stufe 2: Titelverbindung

1,82 g 4-Hydroxy-2-(benzyloximinoeth-1'-yl)-pyrimidin, 2,15 g E-2-Methoxyimino-2-[2-(bromomethyl)phenyl]essigsäuremethylester und 1,55 g Kaliumcarbonat wurden in 30 ml Dimethylformamid für 4 Stunden bei 50°C dann 14 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde mit Wasser versetzt und anschließend mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und erneut eingeeengt. Das verbleibende Rohprodukt wurde an Kieselgel mit Cyclohexan/Methyl-tert.-butylether 1:1 gereinigt. Man erhielt 1,7 g der Titelverbindung als helles Harz.

IR (cm⁻¹): 1728, 1567, 1440, 1323, 1288, 1220, 1069, 1046, 1019, 986.

Beispiel 2: E-2-Methoxyimino-2-[(2-[2-(benzyloximinoeth-1'-yl)-pyrimidin-4-yl]oxy-methyl)phenyl]essigsäuremethylesteramid (Verbindung Nr. I.39)

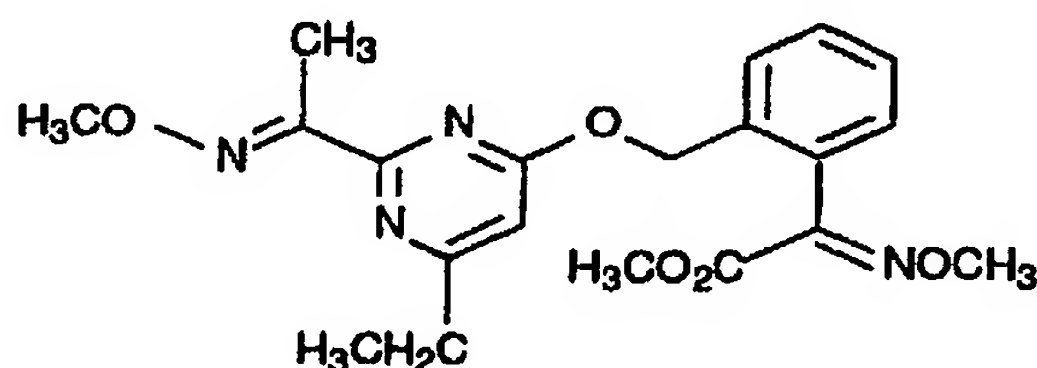
40



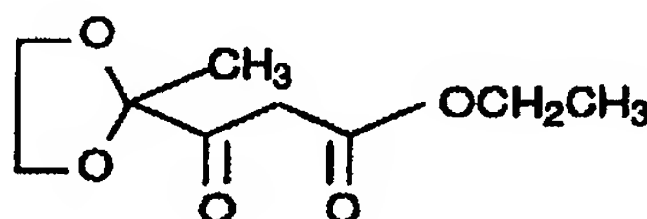
4,4 g des Methylesters (Titelverbindung aus Beispiel 1) wurden in 80 ml Tetrahydrofuran gelöst und mit 3,0 g 40%-iger wäßriger Methylaminlösung versetzt. Man rührte 5 Stunden bei 45°C. Nach dem Abkühlen wurde die Reaktionsmischung eingeeengt. Der verblei-

bende Rückstand wurde in 100 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und abschließend bis zur Trockne eingedampft. Es verblieben 4,3 g der Titelverbindung als farbloser Feststoff (Fp.: 83 - 84°C).

Beispiel 3: E-2-Methoxyimino-2-[(2-[2-ethyl-6-(methoximinoeth-1'-yl)-pyrimidin-4-yl])oxy-methyl]phenyl]essigsäuremethylester (Verbindung Nr. I.1)

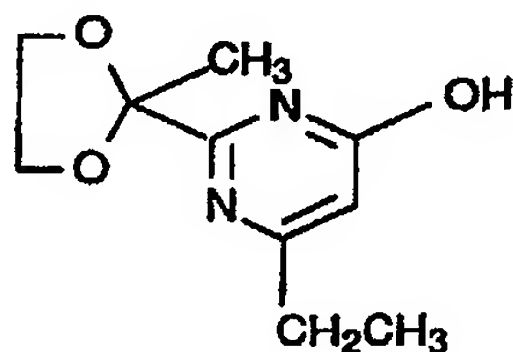


Stufe 1: 3-(2-Methyl-1,3-dioxolan-2-yl)-3-oxo-propionsäureethylester



236 g Kalium-tert.-butylat wurden in 1,3 l Diethylcarbonat suspendiert und auf 60°C erhitzt. Bei dieser Temperatur wurden 1 mol 2-Methyl-2-acetyl-1,3-dioxolan, gelöst in 500 ml Diethylcarbonat, innerhalb von drei Stunden zugetropft. Es wurde drei Stunden bei 60°C nachgerührt. Nach dem Abkühlen wurde auf 2 l 10 %-ige Schwefelsäure gegossen, die organische Phase abgetrennt und die wäßrige Phase mit Essigester extrahiert. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phasen und Abdampfen des Diethylcarbonats verblieb das Rohprodukt, das durch Vakuumdestillation aufgereinigt wurde. Man erhielt das Produkt in 65 % Ausbeute (Kp.: 69 - 72°C/0.08 mbar).

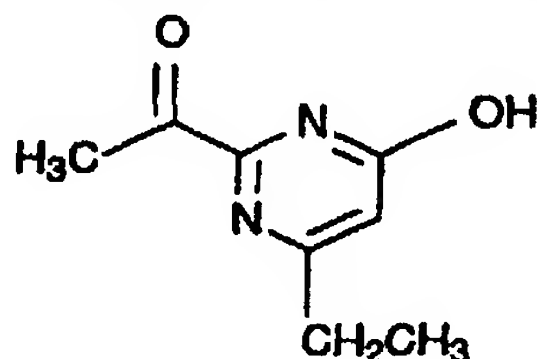
Stufe 2: 4-Hydroxy-2-ethyl-6-(2-Methyl-1,3-dioxolan-2-yl)-pyrimidin



54,3 g Propionamidinhydrochlorid wurde in 350 ml Ethanol gelöst. 90 g 30 %-ige Natriummethanolatlösung wurde innerhalb 30 Minuten zugetropft. Es wurde 15 Minuten nachgerührt. Dann wurden 101 g des Produkts aus Stufe 1 innerhalb einer Stunde zugetropft. Es

wurde acht Stunden zum Rückfluß erhitzt, dann 14 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde eingengt. Der verbleibende Rückstand wurde in 320 ml 10%-ige Natronlauge gelöst, dann drei mal mit je 150 ml Methyl-tert.-butylether gewaschen. Die wäßrige Phase wurde mit Salzsäure auf pH 5 gestellt. Das daraufhin ausfallende Produkt wurde abfiltriert und getrocknet. Man erhielt so 47,6 g des Produkts als farblosen Feststoff (Fp.: 117 -120°C).

10 Stufe 3: 4-Hydroxy-2-ethyl-6-acetyl-pyrimidin

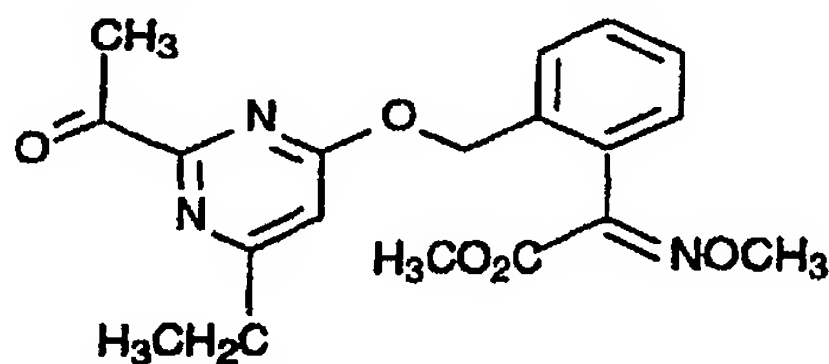


15

20 g des Pyrimidins aus Stufe 2 wurden in 200 ml Dioxan vorgelegt. 100 ml 5N Salzsäure wurden bei Raumtemperatur zugetropft. Es wurde drei Stunden zum Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde das Reaktionsgemisch auf Eis gegossen, mit verdünnter Natronlauge neutralisiert, mit Natriumchlorid gesättigt und mit Essigester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet. Nach Abdampfen des Lösungsmittels verblieb das Produkt als farbloser Feststoff (Fp.: 153 - 155°C).

25

Stufe 4: E-2-Methoxyimino-2-[(2-[2-ethyl-6-acetyl-pyrimidin-4-yl])oxy-methyl]phenyl]essigsäuremethylester



30

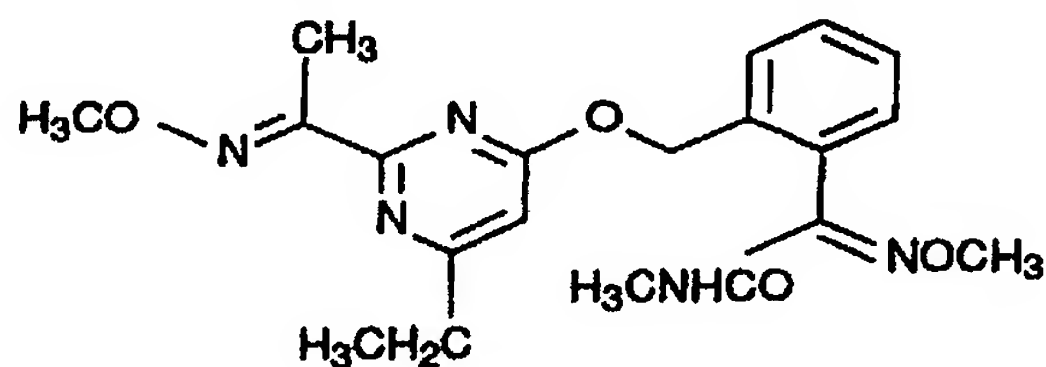
7 g des Pyrimidins aus Stufe 3, 12 g E-2-Methoxyimino-2-[2-(brommethyl)phenyl]essigsäuremethylester und 10 g Kaliumcarbonat wurden in 250 ml Dimethylformamid für 8 Stunden bei 60°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde filtriert. Der nach dem Einengen des Filtrats verbleibende Rückstand wurde in Essigester gelöst. Diese organische Phase wurde mit verdünnter Natronlauge, dann mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und erneut eingengt. Das verbleibende Rohprodukt wurde ohne weitere Reinigung in Stufe 5 eingesetzt.

45

Stufe 5: Titelverbindung

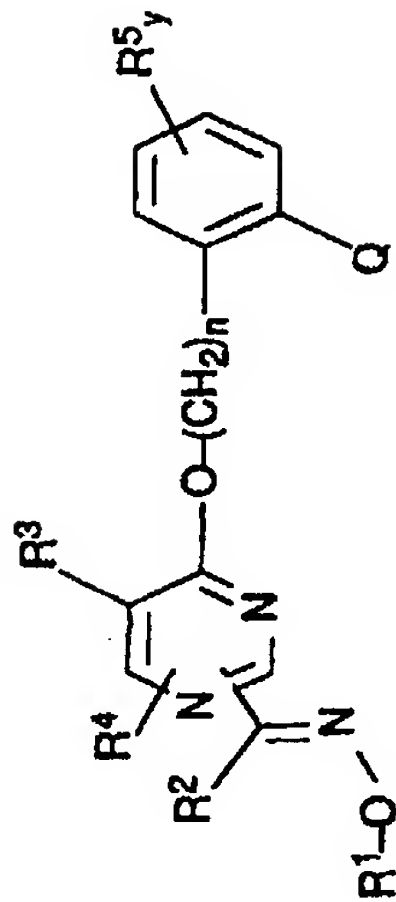
2g des Produkts aus Stufe 4 und 0,5 g Methoxyaminhydrochlorid wurden in 100ml Methanol 6 Stunden zum Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde filtriert. Der nach dem Einengen des Filtrats verbleibende Rückstand wurde in Essigester gelöst. Diese organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und erneut eingeeengt. Das verbleibende Rohprodukt wurde an Kieselgel mit Heptan/Essigester 8:2 gereinigt. Man erhielt so 1g der Titelverbindung als farblosen Feststoff. (Fp.: 90-92°C).

Beispiel 4: E-2-Methoxyimino-2-[(2-[2-ethyl-6-(methoximino-eth-1'-yl)-pyrimidin-4-yl)]oxy-methyl)phenyl]essigsäuremethylester (Verbindung Nr. I.23)



0,3 g des Methylesters (Titelverbindung aus Beispiel 3) wurden in 100 ml Tetrahydrofuran gelöst und mit 50 ml 40%-iger wäßriger Methylaminlösung versetzt. Man rührte 8 Stunden bei 40°C. Nach dem Abkühlen wurde der Ansatz eingeeengt. Der verbleibende Rückstand wurde in 100 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommen. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und abschließend bis zur Trockne eingedampft. Es verblieben 0,3 g der Titelverbindung als helles Harz.

Tabelle



Nr.	R ¹	R ²	R ³	n	#	R ⁴	R ^{5y}	Q	phys. Daten ^a
I.1	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	90-92
I.2	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.3	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.4	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.5	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.6	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.7	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.8	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.9	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	103-106
I.10	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.11	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.12	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.13	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.14	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz

Nr.	R ¹	R ²	R ³	n	#	R ⁴	R ⁵ _y	Q	phys. Daten ^a
I.15	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.16	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.17	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.18	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.19	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.20	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.21	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-(CH ₂) ₂ CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=CHOCH ₃	Harz
I.22	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₃	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.23	CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₂ CH ₃	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.24	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	6	2-CH ₃	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	Harz
I.25	CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	1670, 1568, 1527, 1461, 1441, 1324, 1290, 1048, 979
I.26	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	67- 68
I.27	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	1671, 1568, 1527, 1441, 1323, 1292, 1091, 1047, 1000, 980
I.28	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	1728, 1567, 1440, 1323, 1288, 1220, 1069, 1047, 1020, 985
I.29	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	1672, 1568, 1526, 1441, 1324, 1291, 1038, 1004, 980
I.30	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	78- 80

Nr.	R ¹	R ²	R ³	n	#	R ⁴	R ⁵ _y	Q	phys. Data ^a
I.31	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	100-102
I.32	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	1729, 1567, 1440, 1323, 1287, 1220, 1069, 1045, 1020, 985
I.33	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	1671, 1568, 1527, 1440, 1324, 1291, 1037, 979
I.34	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	1729, 1567, 1462, 1440, 1323, 1288, 1220, 1079, 1039, 1021
I.35	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	1671, 1568, 1527, 1462, 1440, 1324, 1292, 1038, 979
I.36	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	1729, 1566, 1461, 1440, 1322, 1287, 1220, 1070, 1017, 986
I.37	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	98-100
I.38	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CO ₂ CH ₃)=NOCH ₃	1728, 1567, 1440, 1323, 1288, 1220, 1069, 1046, 1019, 986
I.39	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃	H	1	2	H	H	C(CONHCH ₃)=NOCH ₃	83-84
I.40	CH ₃	CH ₃	H	1	2	H	H	N(OCH ₃)CO ₂ CH ₃	69-71

a: Fp. (°C); IR (cm⁻¹); ¹H-NMR (δ in ppm)

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I 5 ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden als 20%-ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis 10 ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor® EL (Emulan® EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

15 Wirkung gegen *Plasmopara viticola* (Rebenperonospora)

Topfreben (Sorte: "Müller Thurgau") wurden mit der Wirkstoffaufbereitung tropfnaß gespritzt (Aufwandmenge: 250 ppm). Nach 8 Tagen wurden die Pflanzen mit einer Zoosporenaufschwemmung des 20 Pilzes *Plasmopara viticola* besprüht und 5 Tage bei 20-30°C bei hoher Luftfeuchtigkeit aufbewahrt. Vor der Beurteilung wurden die Pflanzen danach für 16h bei hoher Luftfeuchtigkeit aufbewahrt. Die Auswertung erfolgte visuell.

25 In diesem Test zeigten die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen 1, 3, 5, 7, 11, 14, 17, 18, 20, 22, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38 und 39 behandelten Pflanzen einen Befall von 15% und weniger während die unbehandelten (Kontroll-) Pflanzen zu 80% befallen waren.

30

Beispiele für die Wirkung gegen tierische Schädlinge

Die Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I gegen tierische Schädlinge ließ sich durch folgende Versuche zeigen:

35

Die Wirkstoffe wurden

- a. als 0,1%-ige Lösung in Aceton oder
- b. als 10%-ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor® EL (Emulan® EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole) 40 aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Aceton im Fall von a. bzw. mit Wasser im Fall von b. verdünnt.

45

Nach Abschluß der Versuche wurde die jeweils niedrigste Konzentration ermittelt, bei der die Verbindungen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollversuchen noch eine 80 bis 100%-ige Hemmung bzw. Mortalität hervorriefen (Wirkschwelle bzw. Minimalkonzentration).

10

15

20

25

30

35

40

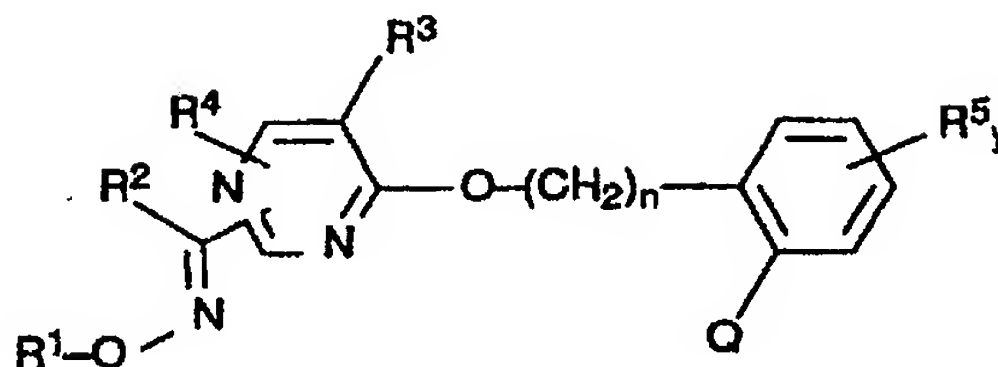
45

Patentansprüche

1. Pyrimidyl-phenyl- und -benzylether der Formel I,

5

10



sowie deren Salze und N-Oxide, in denen die Substituenten und Indices die folgende Bedeutung haben:

15 Q C(CO₂CH₃)=CHCH₃, C(CO₂CH₃)=CHOCH₃, C(CONHCH₃)=CHOCH₃,
C(CONH₂)=NOCH₃, C(CONHCH₃)=NOCH₃ oder N(OCH₃)-CO₂CH₃;

n 0 oder 1;

20 R¹ Wasserstoff oder

ein über ein Kohlenstoff-Atom gebundener organischer Rest;

25 R² Wasserstoff, Cyano, Halogen oder

ein über ein Kohlenstoff-, Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom gebundener organischer Rest;

30 R³ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl;

R⁴ Wasserstoff, Cyano, Nitro, Halogen oder

35 ein über ein Kohlenstoff-, Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom gebundener organischer Rest;

y 0, 1, 2 oder 3, wobei die Reste R⁵ verschieden sein können, wenn y für 2 oder 3 steht;

40

R⁵ Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen R¹ für
45 Wasserstoff oder eine der folgenden Gruppen steht:

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Heteroaryl.

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen R² für Wasserstoff oder eine der folgenden Gruppen steht:
ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Gruppen direkt (über ein Kohlenstoff-Atom) oder über ein Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom an das Gerüst gebunden sind.

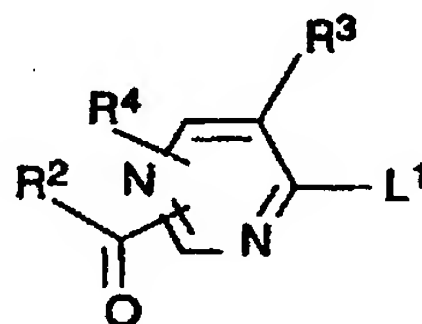
10

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen R⁴ für Cyano, Nitro, Halogen oder eine der folgenden Gruppen steht:
ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Heteroaryl, wobei diese Gruppen direkt (über ein Kohlenstoff-Atom) oder über ein Sauerstoff-, Schwefel- oder Stickstoff-Atom an das Gerüst gebunden sind.

15

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Pyrimidinderivat der Formel IIa

20

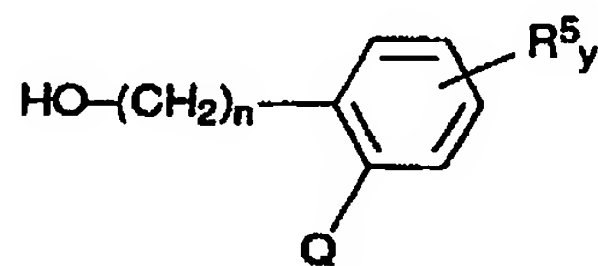


IIa

25

in der L¹ für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe steht, in einem inerten Lösungsmittel mit einem Phenol bzw. Benzylalkohol der Formel IIIa

30

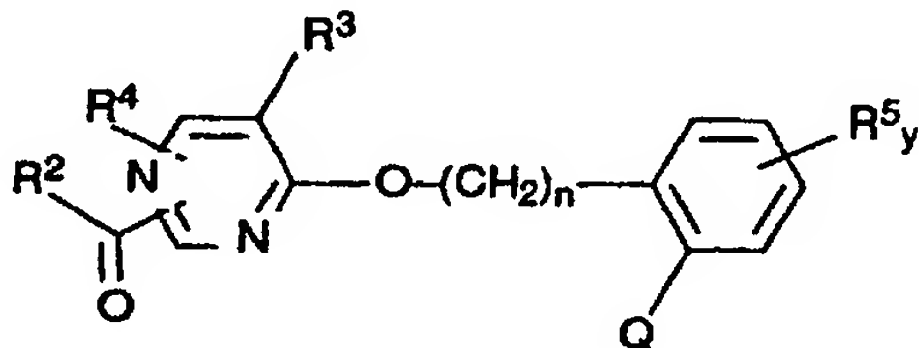


IIIa

35

in den entsprechenden Ether der Formel IVa

40

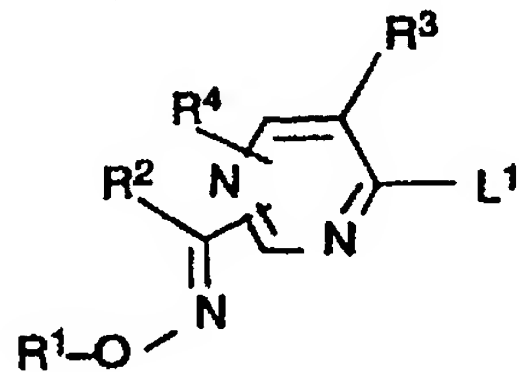


IVa

überführt und IVa anschließend mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R¹-O-NH₂) oder dessen Salz zu I umgesetzt.

45

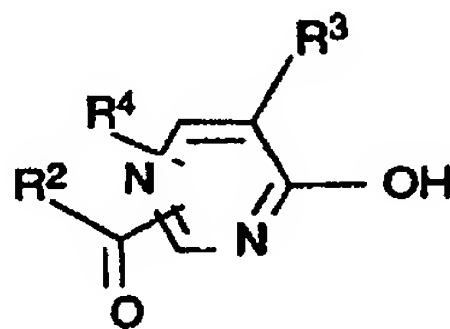
6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Pyrimidinderivat der Formel IIa gemäß Anspruch 5 mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz in die entsprechende Verbindung der Formel Va



Va

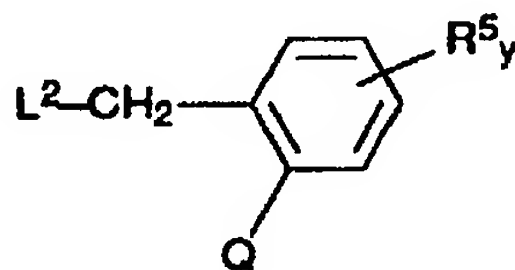
überführt und Va anschließend in einem inerten Lösungsmittel mit einem Phenol bzw. Benzylalkohol der Formel IIIa gemäß Anspruch 5 zu I umsetzt.

7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, in denen n für 1 steht, dadurch gekennzeichnet, daß man einen Pyrimidinalkohol der Formel IIb



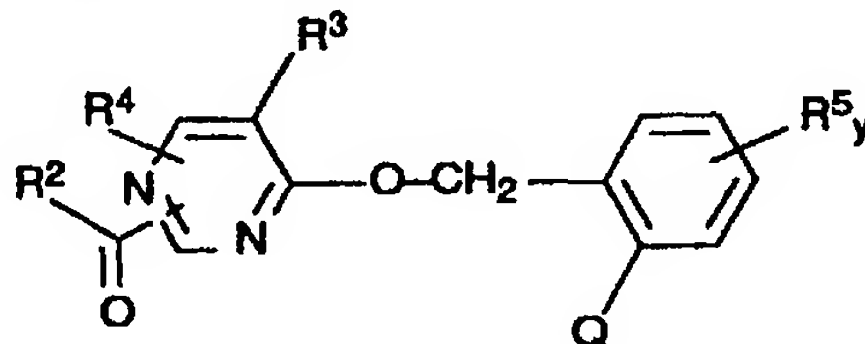
IIb

in einem inerten Lösungsmittel mit einer Benzylverbindung der Formel IIIb



IIIb

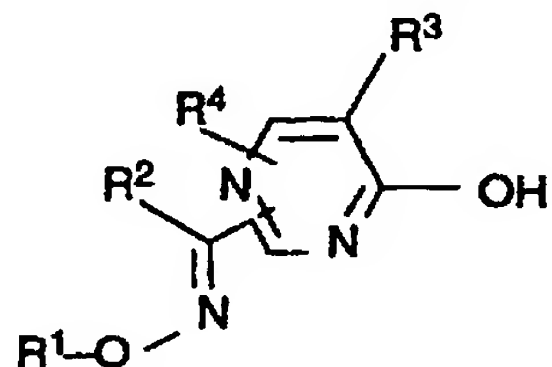
in der L^2 für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe steht, in den entsprechenden Benzylether der Formel IVb



IVb

überführt und IVb anschließend mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz zu I umsetzt.

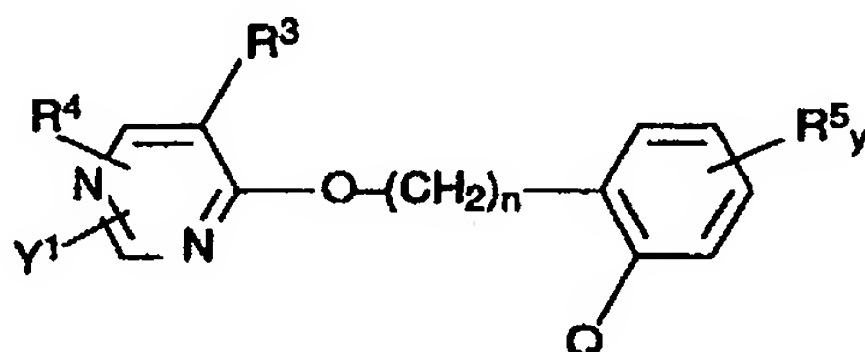
8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, in denen n für 1 steht, dadurch gekennzeichnet, daß man einen Pyridinalkohol der Formel IIb gemäß Anspruch 7 mit einem O-substituierten Hydroxylamin (R^1-O-NH_2) oder dessen Salz in die entsprechende Verbindung der Formel Vb überführt



Vb

und Vb anschließend in einem inerten Lösungsmittel mit einer Benzylverbindung der Formel IIIb gemäß Anspruch 7 zu I umgesetzt.

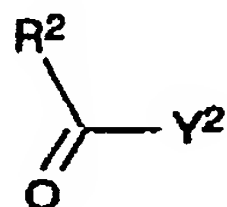
9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen IVa gemäß Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet, daß man einen Ether der Formel Xa



Xa

in der Y^1 für ein Halogenatom steht, entweder

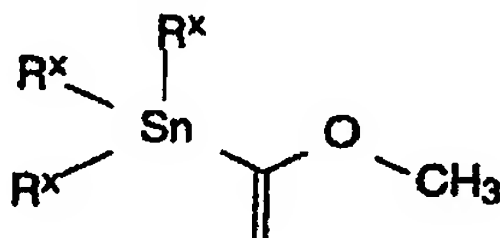
- a) in Gegenwart einer metallorganischen Base in einem inerten Lösungsmittel mit einer aktivierten Carbonsäure der Formel VIIb



VIIb

in der Y^2 für ein Halogenatom, einen Amid- oder einen Esterrest steht, oder einem entsprechenden Cyanid $R^2-C\equiv N$, oder

- b) in einem inerten Lösungsmittel mit einer Zinn-organischen Verbindung der Formel XI



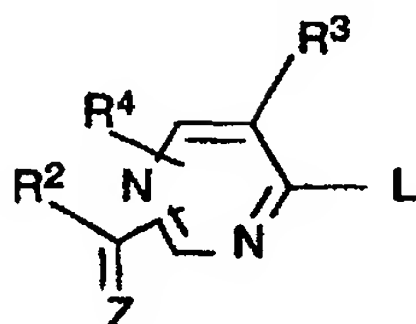
XI

in der die Reste R^x voneinander unabhängig für Alkyl stehen,

umsetzt.

10. Verbindungen der allgemeinen Formel II

5



II

10 in der die Substituenten R², R³ und R⁴ und der Index x die in Anspruch 1 gegebene Beutung haben und L und Z für die folgenden Gruppen stehen:

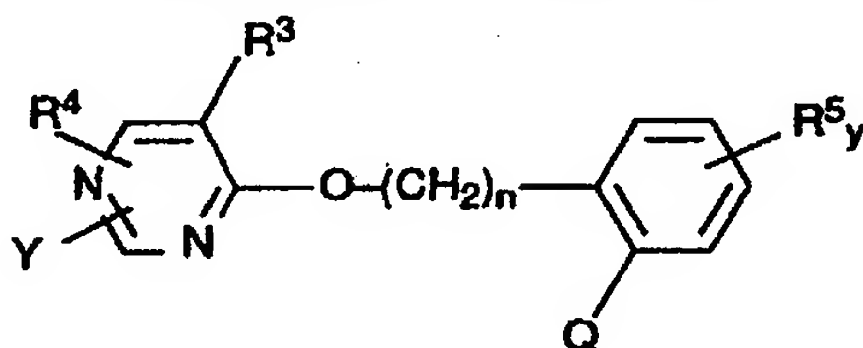
15 L Hydroxy oder eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe;

Z Sauerstoff oder eine Gruppe NOR¹, wobei R¹ die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung hat.

20 11. Verwendung von Verbindungen II gemäß Anspruch 10 als Zwischenprodukte.

12. Verbindungen der allgemeinen Formel X

25



X

30 in der die Substituenten Q, R², R³, R⁴ und R⁵ und die Indices n, x und Y die in Anspruch 1 gegebene Beutung haben und Y für die folgenden Gruppen steht:
Halogen oder CO-R², wobei R² die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung hat.

35

13. Verwendung von Verbindungen X gemäß Anspruch 12 als Zwischenprodukte.

40 14. Zur Bekämpfung von Schädlingen oder Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.

45 15. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schädlingen oder Schadpilzen geeigneten Mittels.

16. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

17. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Schädlinge oder die vor ihnen zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

15

20

25

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 97/01123

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07D239/32 A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 6 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 93 15046 A (BASF AG) 5 August 1993 cited in the application * see specially example 54, S. 138, example 19, S. 261* see the whole document ---	1-9, 12-17
X	WO 95 26956 A (SHIONOGI & CO ; TAKASE AKIRA (JP); KAI HIROYUKI (JP); NISHIDA KUNIY) 12 October 1995 see the whole document	1-9, 12-17
X,P	& EP 0 754 684 A (SHIONOGI & CO., LTD.) 22 January 1997 ---	1-9, 12-17
X	EP 0 513 580 A (BASF AG) 19 November 1992 cited in the application see the whole document ---	1-9, 12-17
-/--		

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

*** Special categories of cited documents :**

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

17 June 1997

Date of mailing of the international search report

15.07.97

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Stellmach, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 97/01123

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 407 873 A (BASF AG) 16 January 1991 cited in the application see the whole document ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 398 692 A (SHIONOGI & CO) 22 November 1990 cited in the application see the whole document ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 363 818 A (BASF AG) 18 April 1990 cited in the application see the whole document ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 350 691 A (BASF AG) 17 January 1990 cited in the application see the whole document ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 278 595 A (ICI PLC) 17 August 1988 cited in the application see the whole document ---	1-9, 12-17
Y	WO 95 32182 A (SHIONOGI & CO ;MURABAYASHI AKIRA (JP); TAKASE AKIRA (JP); TAKENAKA) 30 November 1995 see the whole document & EP 0 760 363 A ---	1-9, 12-17
X	CHEM. PHARM. BULL., vol. 32, no. 5, 1984, TOKYO, pages 2005-2014, XP002033145 SAKAMOTO, T. ET AL.: "Studies on Pyrimidine Derivatives. XXXVI. Reaction of 6-Substituted 2,4-Dimethylpyrimidines with Benzaldehyde in the Presence of Zinc Chloride " * see page 2006, compound 20* see the whole document ---	10,11
P,X	WO 96 16047 A (BASF AG ;KIRSTGEN REINHARD (DE); OBERDORF KLAUS (DE); SCHUETZ FRAN) 30 May 1996 see the whole document -----	1-9, 12-17

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/01123

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9315046 A	05-08-93	DE 4234012 A	14-04-94
		DE 4234028 A	14-04-94
		DE 4234067 A	14-04-94
		DE 4234081 A	14-04-94
		AU 671974 B	19-09-96
		AU 3351493 A	01-09-93
		AU 5246596 A	25-07-96
		BR 9305817 A	26-12-95
		CA 2127110 A	05-08-93
		CZ 9401785 A	15-02-95
		EP 0624155 A	17-11-94
		FI 943523 A	27-07-94
		HU 69026 A	28-08-95
		JP 7502747 T	23-03-95
		NO 942814 A	28-07-94
		NZ 246603 A	28-10-96
		SK 90794 A	10-05-95
		ZA 9300604 A	28-07-94
WO 9526956 A	12-10-95	AU 2084395 A	23-10-95
		CA 2186947 A	12-10-95
		CN 1144524 A	05-03-97
		EP 0754684 A	22-01-97
EP 0513580 A	19-11-92	DE 4116090 A	19-11-92
		AT 144502 T	15-11-96
		AU 648664 B	28-04-94
		AU 1626892 A	19-11-92
		CA 2068017 A	18-11-92
		DE 59207401 D	28-11-96
		ES 2094842 T	01-02-97
		JP 5213815 A	24-08-93
		NZ 242758 A	22-12-94
		US 5298527 A	29-03-94
		US 5416068 A	16-05-95
		ZA 9203534 A	15-11-93
EP 0407873 A	16-01-91	DE 3923068 A	24-01-91
		AU 624727 B	18-06-92
		AU 5902590 A	17-01-91

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/01123

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0407873 A		CA 2021029 A	14-01-91
		DE 59002887 D	04-11-93
		ES 2059903 T	16-11-94
		JP 3052871 A	07-03-91
		US 5047408 A	10-09-91
		US 5106852 A	21-04-92

EP 0398692 A	22-11-90	AT 141589 T	15-09-96
		AT 145891 T	15-12-96
		AU 628972 B	24-09-92
		AU 5508890 A	22-11-90
		CA 2017076 A	17-11-90
		DE 69028136 D	26-09-96
		DE 69028136 T	23-01-97
		DE 69029334 D	16-01-97
		DE 69029334 T	30-04-97
		EP 0629609 A	21-12-94
		ES 2093013 T	16-12-96
		ES 2097583 T	01-04-97
		JP 8253449 A	01-10-96
		JP 8231310 A	10-09-96
		JP 2558001 B	27-11-96
		JP 3246268 A	01-11-91
		KR 9502600 B	23-03-95
		US 5371223 A	06-12-94
		US 5401877 A	28-03-95
		US 5548078 A	20-08-96
		US 5185342 A	09-02-93
		US 5371222 A	06-12-94

EP 0363818 A	18-04-90	DE 3835028 A	19-04-90
		AU 626327 B	30-07-92
		AU 4282089 A	26-04-90
		DE 58907393 D	11-05-94
		ES 2063094 T	01-01-95
		JP 2164866 A	25-06-90
		US 5468717 A	21-11-95
		US 5554578 A	10-09-96
		US 5334577 A	02-08-94

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/01123

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0350691 A	17-01-90	DE 3823991 A AT 123023 T AU 616031 B AU 3811689 A DE 58909248 D ES 2072276 T JP 2088558 A US 5157037 A US 5194438 A US 5326767 A US 5378711 A	15-02-90 15-06-95 17-10-91 01-02-90 29-06-95 16-07-95 28-03-90 20-10-92 16-03-93 05-07-94 03-01-95
EP 0278595 A	17-08-88	AU 615890 B AU 1066088 A CN 1030749 A DE 3875748 A DE 3889345 D DE 3889345 T EG 19678 A EP 0472224 A ES 2052696 T ES 2053258 T GB 2201152 A,B GB 2235454 A,B GB 2235455 A,B GB 2235456 A,B IE 60730 B IL 85122 A IL 98742 A IL 98743 A JP 2559130 B JP 63216848 A JP 9002906 A KR 9613832 B KR 9605513 B US 5438059 A US 5021581 A	17-10-91 11-08-88 01-02-89 17-12-92 01-06-94 01-09-94 30-09-95 26-02-92 16-07-94 16-07-94 24-08-88 06-03-91 06-03-91 06-03-91 10-08-94 29-12-94 18-06-96 16-10-96 04-12-96 09-09-88 07-01-97 10-10-96 25-04-96 01-08-95 04-06-91
WO 9532182 A	30-11-95	AU 2419895 A CA 2190830 A	18-12-95 30-11-95

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 97/01123

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9532182 A		EP 0760363 A	05-03-97

WO 9616047 A	30-05-96	DE 4440930 A	23-05-96
		DE 19526661 A	23-01-97
		AU 3871495 A	17-06-96

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Int.-nationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01123

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 6 C07D239/32 A01N43/54

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 93 15046 A (BASF AG) 5. August 1993 in der Anmeldung erwähnt * siehe insbesondere Beisp. 54, S. 138, Beisp. 19, S. 261 * siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
X	WO 95 26956 A (SHIONOGI & CO ; TAKASE AKIRA (JP); KAI HIROYUKI (JP); NISHIDA KUNIY) 12. Oktober 1995 siehe das ganze Dokument X, P & EP 0 754 684 A (SHIONOGI & CO., LTD.) 22. Januar 1997 ---	1-9, 12-17
X	EP 0 513 580 A (BASF AG) 19. November 1992 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
-/-		

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

17. Juni 1997

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

15. 07. 97

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Stellmach, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 97/01123

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 407 873 A (BASF AG) 16.Januar 1991 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 398 692 A (SHIONOGI & CO) 22.November 1990 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 363 818 A (BASF AG) 18.April 1990 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 350 691 A (BASF AG) 17.Januar 1990 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
Y	EP 0 278 595 A (ICI PLC) 17.August 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-9, 12-17
Y	WO 95 32182 A (SHIONOGI & CO ;MURABAYASHI AKIRA (JP); TAKASE AKIRA (JP); TAKENAKA) 30.November 1995 siehe das ganze Dokument & EP 0 760 363 A ---	1-9, 12-17
X	CHEM.PHARM.BULL., Bd. 32, Nr. 5, 1984, TOKYO, Seiten 2005-2014, XP002033145 SAKAMOTO,T. ET AL.: "Studies on Pyrimidine Derivatives.XXXVI.Reaction of 6-Substituted 2,4-Dimethylpyrimidines with Benzaldehyde in the Presence of Zinc Chloride " * siehe Seite 2006, Verb. 20 * siehe das ganze Dokument ---	10,11
P,X	WO 96 16047 A (BASF AG ;KIRSTGEN REINHARD (DE); OBERDORF KLAUS (DE); SCHUETZ FRAN) 30.Mai 1996 siehe das ganze Dokument -----	1-9, 12-17

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01123

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9315046 A	05-08-93	DE 4234012 A	14-04-94
		DE 4234028 A	14-04-94
		DE 4234067 A	14-04-94
		DE 4234081 A	14-04-94
		AU 671974 B	19-09-96
		AU 3351493 A	01-09-93
		AU 5246596 A	25-07-96
		BR 9305817 A	26-12-95
		CA 2127110 A	05-08-93
		CZ 9401785 A	15-02-95
		EP 0624155 A	17-11-94
		FI 943523 A	27-07-94
		HU 69026 A	28-08-95
		JP 7502747 T	23-03-95
		NO 942814 A	28-07-94
		NZ 246603 A	28-10-96
		SK 90794 A	10-05-95
		ZA 9300604 A	28-07-94
WO 9526956 A	12-10-95	AU 2084395 A	23-10-95
		CA 2186947 A	12-10-95
		CN 1144524 A	05-03-97
		EP 0754684 A	22-01-97
EP 0513580 A	19-11-92	DE 4116090 A	19-11-92
		AT 144502 T	15-11-96
		AU 648664 B	28-04-94
		AU 1626892 A	19-11-92
		CA 2068017 A	18-11-92
		DE 59207401 D	28-11-96
		ES 2094842 T	01-02-97
		JP 5213815 A	24-08-93
		NZ 242758 A	22-12-94
		US 5298527 A	29-03-94
		US 5416068 A	16-05-95
		ZA 9203534 A	15-11-93
EP 0407873 A	16-01-91	DE 3923068 A	24-01-91
		AU 624727 B	18-06-92
		AU 5902590 A	17-01-91

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01123

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0407873 A		CA 2021029 A DE 59002887 D ES 2059903 T JP 3052871 A US 5047408 A US 5106852 A	14-01-91 04-11-93 16-11-94 07-03-91 10-09-91 21-04-92
EP 0398692 A	22-11-90	AT 141589 T AT 145891 T AU 628972 B AU 5508890 A CA 2017076 A DE 69028136 D DE 69028136 T DE 69029334 D DE 69029334 T EP 0629609 A ES 2093013 T ES 2097583 T JP 8253449 A JP 8231310 A JP 2558001 B JP 3246268 A KR 9502600 B US 5371223 A US 5401877 A US 5548078 A US 5185342 A US 5371222 A	15-09-96 15-12-96 24-09-92 22-11-90 17-11-90 26-09-96 23-01-97 16-01-97 30-04-97 21-12-94 16-12-96 01-04-97 01-10-96 10-09-96 27-11-96 01-11-91 23-03-95 06-12-94 28-03-95 20-08-96 09-02-93 06-12-94
EP 0363818 A	18-04-90	DE 3835028 A AU 626327 B AU 4282089 A DE 58907393 D ES 2063094 T JP 2164866 A US 5468717 A US 5554578 A US 5334577 A	19-04-90 30-07-92 26-04-90 11-05-94 01-01-95 25-06-90 21-11-95 10-09-96 02-08-94

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01123

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0350691 A	17-01-90	DE 3823991 A	15-02-90
		AT 123023 T	15-06-95
		AU 616031 B	17-10-91
		AU 3811689 A	01-02-90
		DE 58909248 D	29-06-95
		ES 2072276 T	16-07-95
		JP 2088558 A	28-03-90
		US 5157037 A	20-10-92
		US 5194438 A	16-03-93
		US 5326767 A	05-07-94
		US 5378711 A	03-01-95
EP 0278595 A	17-08-88	AU 615890 B	17-10-91
		AU 1066088 A	11-08-88
		CN 1030749 A	01-02-89
		DE 3875748 A	17-12-92
		DE 3889345 D	01-06-94
		DE 3889345 T	01-09-94
		EG 19678 A	30-09-95
		EP 0472224 A	26-02-92
		ES 2052696 T	16-07-94
		ES 2053258 T	16-07-94
		GB 2201152 A,B	24-08-88
		GB 2235454 A,B	06-03-91
		GB 2235455 A,B	06-03-91
		GB 2235456 A,B	06-03-91
		IE 60730 B	10-08-94
		IL 85122 A	29-12-94
		IL 98742 A	18-06-96
		IL 98743 A	16-10-96
		JP 2559130 B	04-12-96
		JP 63216848 A	09-09-88
		JP 9002906 A	07-01-97
		KR 9613832 B	10-10-96
		KR 9605513 B	25-04-96
		US 5438059 A	01-08-95
		US 5021581 A	04-06-91
WO 9532182 A	30-11-95	AU 2419895 A	18-12-95
		CA 2190830 A	30-11-95

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 97/01123

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9532182 A		EP 0760363 A	05-03-97
-----		-----	-----
WO 9616047 A	30-05-96	DE 4440930 A	23-05-96
		DE 19526661 A	23-01-97
		AU 3871495 A	17-06-96
-----		-----	-----